

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
26. August 2004 (26.08.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2004/072025 A2**

(51) Internationale Patentklassifikation: C07D  
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/001342  
(22) Internationales Anmeldedatum:  
13. Februar 2004 (13.02.2004)  
(25) Einreichungssprache: Deutsch  
(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch  
(30) Angaben zur Priorität:  
103 06 250.5 14. Februar 2003 (14.02.2003) DE

(74) Anwalt: ISENBRUCK, Günter; Isenbruck Bösl  
Hörschler Wichmann Huhn, Theodor-Heuss-Anlage 12,  
68165 Mannheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,  
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,  
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,  
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,  
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,  
ZW.

(71) Anmelder: AVENTIS PHARMA DEUTSCHLAND  
GMBH [DE/DE]; 65926 Frankfurt am Main (DE).

(72) Erfinder: SCHWINK, Lothar; Am Hintertor 2, 35260  
stadthallendorf (DE). STENGELIN, Siegfried; Sach-  
senring 27, 65817 Eppstein (DE). GOSSEL, Matthias;  
Im Lorsbachtal 17a, 65719 Hofheim (DE). BÖHME,  
Thomas; Höngenstr. 49, 65428 Rüsselsheim (DE).  
HESSLER, Gerhard; Im Langgewann 53, 65719  
Hofheim (DE). STAHL, Petra; Pestalozzistr. 16, 60385  
Frankfurt (DE). GRETZKE, Dirk; Kaulbachstr. 57,  
60596 Frankfurt (DE).

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,  
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,  
ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT,  
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,  
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

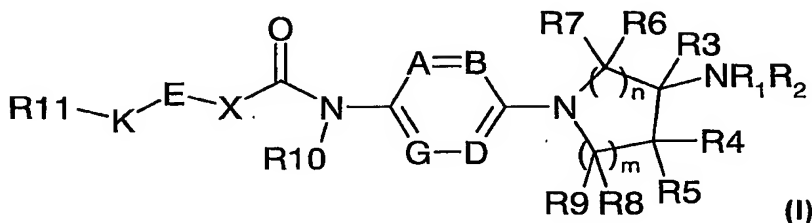
Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu ver-  
öffentlichen nach Erhalt des Berichts

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: SUBSTITUTED N-ARYLHETEROCYCLES, METHOD FOR PRODUCTION AND USE THEREOF AS MEDICA-  
MENTS

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE N-ARYLHETEROZYKLEN, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE  
VERWENDUNG ALS ARZNEIMITTEL



(57) Abstract: The invention relates to N-arylheterocycles and the physiologically-acceptable salts and physiologically-functional derivatives thereof. Compounds of formula (I), where the groups have the given meanings, the N-oxides and the physiologically-acceptable salts and methods for production thereof are disclosed. The compounds are suitable as anorectics for example.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft substituierte N-Arylheterozyklen sowie deren physiologisch verträgliche Salze und physiologisch funktionelle Derivate. Es werden Verbindungen der Formel (I), worin die Reste die angegebenen Bedeutungen haben, deren N-Oxide sowie deren physiologisch verträglichen Salze und Verfahren zu deren Herstellung beschrieben. Die Verbindungen eignen sich z.B. als Anorektika.

WO 2004/072025 A2



---

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*

APD62429PC

---

**Substituierte N-Arylheterozyklen, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre  
Verwendung als Arzneimittel**

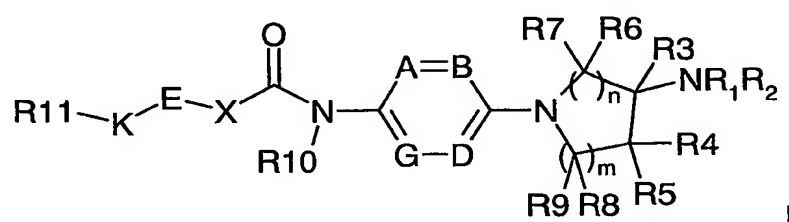
---

Die Erfindung betrifft substituierte N-Arylheterozyklen sowie deren physiologisch verträgliche Salze und physiologisch funktionelle Derivate.

Es sind bereits den hier beschriebenen N-Arylheterozyklen in ihrer Gesamtstruktur ähnliche Verbindungen mit pharmakologischer Wirkung im Stand der Technik beschrieben. So beschreibt z. B. WO 00/35454 Ureido substituierte Phenylpiperidine und -pyrrolidine als Mittel zur Behandlung von Entzündungs- und Autoimmunkrankheiten. Acylamido substituierte Phenylpyrrolidine werden in WO 02/042271 zur Behandlung von Diabetes, Obesitas und Lipidstoffwechselkrankheiten vorgeschlagen.

Der Erfindung lag die Aufgabe zugrunde, Verbindungen zur Verfügung zu stellen, die eine Gewichtsreduktion bei Säugetieren bewirken und die zur Prävention und Behandlung von Obesitas und Diabetes geeignet sind.

Die Erfindung betrifft daher Verbindungen der Formel I,



worin bedeuten

R1, R2      unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl,

APD62429PC

CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, CO-Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, CO-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, COCH=CH(R<sub>13</sub>), COCC(R<sub>14</sub>), CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-S(O)<sub>p</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO(C(R<sub>15</sub>)(R<sub>16</sub>))<sub>q</sub>N(R<sub>17</sub>)(R<sub>18</sub>), CO(C(R<sub>19</sub>)(R<sub>20</sub>))<sub>r</sub>CON(R<sub>21</sub>)(R<sub>22</sub>), CO(C(R<sub>23</sub>)(R<sub>24</sub>))<sub>s</sub>O(R<sub>25</sub>); oder R<sub>1</sub> und R<sub>2</sub> bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi- oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 4 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R<sub>26</sub>), CON(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>), Hydroxy, COO(R<sub>29</sub>), N(R<sub>30</sub>)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R<sub>31</sub>)(R<sub>32</sub>) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

o 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

p 0, 1, 2;

q, r, s unabhängig voneinander 0, 1, 2, 3, 4;

R<sub>13</sub>, R<sub>14</sub> unabhängig voneinander ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R<sub>15</sub>, R<sub>16</sub>, R<sub>17</sub>, R<sub>19</sub>, R<sub>20</sub>, R<sub>21</sub>, R<sub>22</sub>, R<sub>23</sub>, R<sub>24</sub>, R<sub>25</sub>, R<sub>26</sub>, R<sub>27</sub>, R<sub>28</sub>, R<sub>29</sub>, R<sub>30</sub>, R<sub>31</sub>, R<sub>32</sub>

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R<sub>18</sub> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(R<sub>33</sub>);  
oder



APD62429PC

R17 und R18, R21 und R22, R27 und R28, R31 und R32

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

R33 ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R12 OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R80), CON(R81)(R93), N(R82)(R83), 3-12 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der ein oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, Br, J, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, N(R34)(R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38))<sub>t</sub>(R39), CO(C(R37)(R38))<sub>t</sub>(R39), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R40), S(O)<sub>u</sub>(R41) und COOH enthalten kann;

t 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

u 0, 1, 2;

R34, R35, R37, R38

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

APD62429PC

## R34 und R35

optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;

R36, R39 unabhängig voneinander (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R40 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl;

R41 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R78, R79 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl;

R80, R81,

R93 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl;

R82, R83 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

oder

R82 und

R83

optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1

APD62429PC

weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;

R3 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R4, R5 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R6, R7, R8, R9  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl,

oder

R6 und R7, R8 und R9  
unabhängig voneinander optional Oxo;

n, m unabhängig voneinander 0, 1, 2;

A, B, D, G unabhängig voneinander N, C(R42);  
oder  
die Gruppen A und B oder die Gruppen D und G sind jeweils C(R42) und bilden gemeinsam einen 5- oder 6-gliedrigen carbocyclischen oder heterocyclischen Rest, so dass sich insgesamt ein bicyclisches System ergibt;

R42 H, F, Cl, Br, J, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, S-Aryl, N(R43)(R44), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COOH, COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), N(R49)SO<sub>2</sub>(R50), CO(R51), - (CR84R85)<sub>x</sub>-O(R86);

APD62429PC

R43, R44, R45, R46, R47, R49

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

R43 und R44, R45 und R46

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

R48, R50, R51

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;R84, R85 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;R86 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Aryl;

x 1, 2, 3, 4, 5, 6;

R10 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl;

X N(R52), O, eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), C(R55)(R56)O, CO, C≡C, eine Gruppe der Formel -(CR<sub>87</sub>R<sub>88</sub>)<sub>Y</sub>-, worin eine oder mehrere Gruppen -(CR<sub>87</sub>R<sub>88</sub>)- durch Y ersetzt sein können, wobei sich ein chemisch sinnvoller Rest ergibt;

Y O, S, N(R89);

R52, R53, R54, R55, R56

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl

APD62429PC

- R87, R88 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, wobei R87 und R88 in den y Gruppen jeweils die gleichen oder verschiedene Bedeutungen aufweisen können;
- y 2, 3, 4, 5, 6;
- R89 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- E 3-14 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, J, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, S-Aryl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COOH, COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R59)(R60), N(R61)CO(R62), N(R63)SO<sub>2</sub>(R64), CO(R65) tragen und mono- oder bicyclisch sein kann;
- R57, R58, R59, R60, R61, R63  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- oder  
R57 und R58, R59 und R60  
unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;
- R62, R64, R65  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;

APD62429PC

- K** eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C≡C, C=C, eine Gruppe der Formel - (CR90R91)<sub>z</sub>-, worin eine oder mehrere Gruppen -(CR90R91)- durch Z ersetzt sein können, wobei sich ein chemisch sinnvoller Rest ergibt;
- v** 1, 2, 3, 4;
- R66, R67, R68, R69, R70**  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- Z** O, S, N(R92), CO, SO, SO<sub>2</sub>;
- R90, R91** unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, wobei R90 und R91 in den z Gruppen jeweils die gleichen oder verschiedene Bedeutungen aufweisen können;
- z** 2, 3, 4, 5, 6;
- R92** H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- R11** H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi-, tri- oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, COO(R74), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, SCF<sub>3</sub>;
- R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77**  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

oder

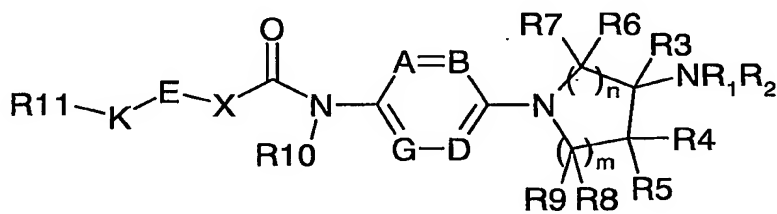
R72 und R73, R76 und R77

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann; oder

E, K und R11 zusammen einen Tricyclus bilden, wobei die Ringe unabhängig voneinander gesättigt, teilgesättigt oder ungesättigt und jeweils 3 – 8 Ringatome enthalten können;

deren N-Oxide sowie deren physiologisch verträgliche Salze.

In einer weiteren Ausführungsform betrifft die Erfindung daher Verbindungen der Formel I,



worin bedeuten

R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-R12, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-R12, CO-Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, CO-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, COCH=CH(R13), COCC(R14), CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-S(O)<sub>p</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO(C(R15)(R16))<sub>q</sub>N(R17)(R18), CO(C(R19)(R20)), CON(R21)(R22), CO(C(R23)(R24))<sub>s</sub>O(R25); oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden

APD62429PC

sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi- oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 4 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, Oxo, CO(R26), CON(R27)(R28), Hydroxy, COO(R29), N(R30)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R31)(R32) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

o 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

p 0, 1, 2;

q, r, s unabhängig voneinander 0, 1, 2, 3, 4;

R13, R14 unabhängig voneinander ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R15, R16, R17, R19, R20, R21, R22, R23, R24, R25, R26, R27, R28, R29, R30, R31, R32

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R18 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(R33);

R17 und R18, R21 und R22, R27 und R28, R31 und R32

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;



APD62429PC

R33 ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R12 OH, 3-12 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der ein oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, Br, J, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, N(R34)(R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R40), S(O)<sub>u</sub> (R41) und COOH enthalten kann;

t 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

u 0, 1, 2;

R34, R35, R37, R38

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R34 und R35

optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;

R36, R39 unabhängig voneinander (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff,

APD62429PC

Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R40 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl;

R41 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R3 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R4, R5 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R6, R7, R8, R9  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R6 und R7, R8 und R9  
unabhängig voneinander optional Oxo;

n, m unabhängig voneinander 0, 1, 2;

A, B, D, G unabhängig voneinander N, C(R42);

R42 H, F, Cl, Br, J, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, S-Aryl, N(R43)(R44), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COOH, COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), N(R49)SO<sub>2</sub>(R50), CO(R51)

APD62429PC

R43, R44, R45, R46, R47, R49

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R43 und R44, R45 und R46

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

R48, R50, R51

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;

R10

H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl;

X

N(R52), O, eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), C(R55)(R56)O;

R52, R53, R54, R55, R56

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl

E

3-8 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, J, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, S-Aryl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COOH, COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R59)(R60), N(R61)CO(R62), N(R63)SO<sub>2</sub>(R64), CO(R65) tragen und mono- oder bicyclisch sein kann;

R57, R58, R59, R60, R61, R63

APD62429PC

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R57 und R58, R59 und R60

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

R62, R64, R65

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;

K eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C≡C;

v 1, 2, 3, 4

R66, R67, R68, R69, R70

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R11 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, COO(R74), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

R72 und R73, R76 und R77

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann; oder

E, K und R11 zusammen einen Tricyclus bilden, wobei die Ringe unabhängig voneinander gesättigt, teilgesättigt oder ungesättigt und jeweils 3 – 8 Ringatome enthalten können;

sowie deren physiologisch verträgliche Salze.

Die Erfindung bezieht sich auf Verbindungen der Formel I, in Form ihrer Racemate, enantiomerenangereicherten Mischungen und reinen Enantiomere sowie auf ihre Diastereomere und Mischungen davon.

Die Alkyl-, Alkenyl- und Alkinyreste in den Substituenten R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, R9, R10, R11, R12, R13, R14, R15, R16, R17, R18, R19, R20, R21, R22, R23, R24, R25, R26, R27, R28, R29, R30, R31, R32, R33, R34, R35, R36, R37, R38, R39, R40, R41, R42, R43, R44, R45, R46, R46, R47, R48, R49, R50, R51, R52, R53, R54, R55, R56, R57, R58, R59, R60, R61, R62, R63, R64, R65, R66, R67, R68, R69, R70, R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77, R78, R79, R80, R81, R82, R83, R84, R85, R86, R87, R88, R89, R90, R91, R92 und R93 können sowohl geradkettig, verzweigt oder optional halogeniert sein.

Unter dem Begriff "Aryl" wird insbesondere eine Phenyl oder Naphthylgruppe verstanden.

Unter einem „Tricyclus“ werden Strukturen mit 3 Ringen verstanden, die durch mehr als eine Bindung miteinander verbunden sind. Beispiele solcher Systeme sind kondensierte Systeme mit 3 Ringen und Spirocyclen mit ankondensiertem Ringsystem.

APD62429PC

In dem Fall, dass R1 und R2 zusammen mit dem Stickstoffatom an das sie gebunden sind, einen Ring bilden, kann dieser Ring mit einem oder mehreren der genannten Substituenten substituiert sein.

Unter die bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur E fallen auch Strukturen, die über ein und dasselbe Atom mit den beiden benachbarten Gruppen K und X verknüpft sind.

Pharmazeutisch verträgliche Salze sind aufgrund ihrer höheren Wasserlöslichkeit gegenüber den Ausgangs- bzw. Basisverbindungen besonders geeignet für medizinische Anwendungen. Diese Salze müssen ein pharmazeutisch verträgliches Anion oder Kation aufweisen. Geeignete pharmazeutisch verträgliche Säureadditionssalze der erfindungsgemäßen Verbindungen sind Salze anorganischer Säuren, wie Salzsäure, Bromwasserstoff-, Phosphor-, Metaphosphor-, Salpeter-, Sulfon- und Schwefelsäure sowie organischer Säuren, wie z.B. Essigsäure, Benzolsulfon-, Benzoe-, Zitronen-, Ethansulfon-, Fumar-, Glucon-, Glykol-, Isethion-, Milch-, Lactobion-, Malein-, Äpfel-, Methansulfon-, Bernstein-, p-Toluolsulfon-, Wein- und Tri-fluoressigsäure. Für medizinische Zwecke wird in besonders bevorzugter Weise das Chlorsalz verwendet. Geeignete pharmazeutisch verträgliche basische Salze sind Ammoniumsalze, Alkalimetallsalze (wie Natrium- und Kaliumsalze) und Erdalkalisalze (wie Magnesium- und Calciumsalze).

Salze mit einem nicht pharmazeutisch verträglichen Anion gehören ebenfalls in den Rahmen der Erfindung als nützliche Zwischenprodukte für die Herstellung oder Reinigung pharmazeutisch verträglicher Salze und/oder für die Verwendung in nicht-therapeutischen, zum Beispiel in-vitro-Anwendungen.

Der hier verwendete Begriff "physiologisch funktionelles Derivat" bezeichnet jedes physiologisch verträgliche Derivat einer erfindungsgemäßen Verbindung der Formel I, z.B. einen Ester, der bei Verabreichung an einen Säuger, wie z.B. den Menschen, in der

APD62429PC

Lage ist, (direkt oder indirekt) eine Verbindung der Formel I oder einen aktiven Metaboliten hiervon zu bilden.

Zu den physiologisch funktionellen Derivaten zählen auch Prodrugs der erfindungsgemäßen Verbindungen. Solche Prodrugs können in vivo zu einer erfindungsgemäßen Verbindung metabolisiert werden. Diese Prodrugs können selbst wirksam sein oder nicht.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auch in verschiedenen polymorphen Formen vorliegen, z. B. als amorphe und kristalline polymorphe Formen. Alle polymorphen Formen der erfindungsgemäßen Verbindungen gehören in den Rahmen der Erfindung und sind ein weiterer Aspekt der Erfindung.

Nachfolgend beziehen sich alle Verweise auf "Verbindung(en) gemäß Formel (I)" auf Verbindung(en) der Formel (I) wie vorstehend beschrieben, sowie ihre Salze, Solvate und physiologisch funktionellen Derivate wie hierin beschrieben.

Können Reste oder Substituenten mehrfach in den Verbindungen der Formel I auftreten, so können sie alle unabhängig voneinander die angegebenen Bedeutungen haben und gleich oder verschieden sein.

In einer besonders bevorzugten Ausführungsform betrifft die vorliegende Erfindung Verbindungen der Formel I,

worin bedeuten:

R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-R12, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-R12, COCH=CH(R13), COCC(R14), CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-S(O)<sub>p</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO(C(R15)(R16))<sub>q</sub>N(R17)(R18), CO(C(R19)(R20))<sub>r</sub>CON(R21)(R22), CO(C(R23)(R24))<sub>s</sub>O(R25); oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem

APD62429PC

Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi- oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterozyklische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl-aryl, Oxo, CO(R26), CON(R27)(R28), Hydroxy, COO(R29), N(R30)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R31)(R32) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, wobei bevorzugt R1 und R2 nicht gleichzeitig H bedeuten und R1 und R2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom bevorzugt keinen Morpholino-Rest darstellen;

o 0, 1, 2, 3, 4;

p 0, 1, 2;

q, r, s unabhängig voneinander 0, 1, 2, 3, bevorzugt sind q, s unabhängig voneinander 1, 2, 3 und r 0, 1, 2, 3;

R13, R14 unabhängig voneinander ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das ein weiteres Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R15, R16, R17, R19, R20, R21, R22, R23, R24, R25, R26, R27, R28, R29, R30, R31, R32  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R18 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(R33);

R17 und R18, R21 und R22, R27 und R28, R31 und R32

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem



APD62429PC

Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

R33 ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R12 OH, 3-12 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der ein oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, CF<sub>3</sub>, CN, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl-aryl, N(R34)(R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R40) und S(O)<sub>u</sub> (R41) enthalten kann, wobei in einer bevorzugten Ausführungsform der Substituent O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl ausgenommen ist, wenn der 3-12 gliedrige Ring Phenyl bedeutet;

t 0, 1, 2, 3, 4;

u 0, 1, 2;

R34, R35, R37, R38

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R34 und R35

optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;

R36, R39 unabhängig voneinander (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe Stickstoff,

APD62429PC

Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R40 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl;

R41 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R3 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R4, R5 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R6, R7, R8, R9  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R6 und R7, R8 und R9  
unabhängig voneinander optional Oxo;

n, m unabhängig voneinander 0, 1, 2, bevorzugt ist m 0, 1, 2 und n 1;

A, B, D, G unabhängig voneinander N, C(R42);

R42 H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-Aryl, N(R43)(R44), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), N(R49)SO<sub>2</sub>(R50), CO(R51)

R43, R44, R45, R46, R47, R49  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

R43 und R44, R45 und R46

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

R48, R50, R51

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;

R10 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

X N(R52), O, eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), C(R55)(R56)O;

R52, R53, R54, R55, R56

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl

E 3-8 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OH, CN, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R59)(R60), N(R61)CO(R62), N(R63)SO<sub>2</sub>(R64), CO(R65) tragen und mono- oder bicyclisch sein kann, bevorzugt weist die Gruppe E in ortho-Position zum Anknüpfungspunkt von X keinen Substituenten aus der Gruppe (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl und N(R57)(R58), worin R57 und R58 gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen 5 - 6 gliedrigen Ring bilden, auf; besonders bevorzugt ist E monocyclisch;

R57, R58, R59, R60, R61, R63

APD62429PC

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R57 und R58, R59 und R60

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann, wobei R59 und R60 bevorzugt nicht gleichzeitig H sind;

R62, R64, R65

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;

K eine Bindung, O, CH<sub>2</sub>O, N(R66), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, C≡C, OCH<sub>2</sub>, CON(R68), bevorzugt eine Bindung, O, CH<sub>2</sub>O, ((CR69)(R70))<sub>v</sub>, C≡C, N(R66);

v 1, 2;

R66, R68, R69, R70

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R11 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, COO(R74), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, bevorzugt ist R11 nicht COO(R74);

R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

R72 und R73, R76 und R77

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, worin

A, B, D, G unabhängig voneinander N oder C(R<sub>42</sub>) bedeuten und die Gesamtzahl der Stickstoffatome in diesem Ring 0-2, bevorzugt 0 oder 1 beträgt.

Ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I, worin

n 1 und

m 1 oder 2 bedeuten.

Insbesondere bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, worin

A, B, D, G unabhängig voneinander N oder C(R<sub>42</sub>) bedeuten und die Gesamtzahl der Stickstoffatome in diesem Ring 0-2, bevorzugt 0 oder 1 beträgt;

n 1 und

m 1 oder 2 bedeuten.

In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform betrifft die vorliegende Erfindung Verbindungen der Formel I,

worin bedeuten:

APD62429PC

R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, CO-Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, COCH=CH(R<sub>13</sub>), COCC(R<sub>14</sub>), CO(C(R<sub>15</sub>)(R<sub>16</sub>))<sub>q</sub>N(R<sub>17</sub>)(R<sub>18</sub>), CO(C(R<sub>19</sub>)(R<sub>20</sub>))<sub>r</sub>CON(R<sub>21</sub>)(R<sub>22</sub>), CO(C(R<sub>23</sub>)(R<sub>24</sub>))<sub>s</sub>O(R<sub>25</sub>); oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi- oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, CF<sub>3</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R<sub>26</sub>), CON(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>), Hydroxy, COO(R<sub>29</sub>), N(R<sub>30</sub>)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R<sub>31</sub>)(R<sub>32</sub>) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;  
 bevorzugt unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, COCH=CH(R<sub>13</sub>), COCC(R<sub>14</sub>), CO(C(R<sub>15</sub>)(R<sub>16</sub>))<sub>q</sub>N(R<sub>17</sub>)(R<sub>18</sub>), CO(C(R<sub>23</sub>)(R<sub>24</sub>))<sub>s</sub>O(R<sub>25</sub>); oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono- oder bicyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, CF<sub>3</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-Aryl, Oxo, CO(R<sub>26</sub>), Hydroxy, N(R<sub>31</sub>)(R<sub>32</sub>) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;  
 besonders bevorzugt unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, CO(C(R<sub>15</sub>)(R<sub>16</sub>))<sub>q</sub>N(R<sub>17</sub>)(R<sub>18</sub>), oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono- oder bicyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann,

APD62429PC

ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff und Stickstoff, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Oxo, CO(R26), Hydroxy, N(R31)(R32);

o 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6; bevorzugt 0, 1, 2, 3, 4; besonders bevorzugt 0, 1, 2, 3;

q, r unabhängig voneinander 1, 2, 3; bevorzugt ist q 1 oder 2;

s 0, 1, 2, 3, 4; bevorzugt 0, 1, 2, 3; besonders bevorzugt 0, 1, 2;

R13, R14 unabhängig voneinander einen Phenylring, der 0-1 Stickstoffatome enthalten kann;

R15, R16, R17, R19, R20, R21, R22, R23, R24, R25, R26, R27, R28, R29, R30, R31, R32

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R18 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(R33); bevorzugt H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl; besonders bevorzugt H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

oder

R17 und R18, R21 und R22, R27 und R28, R31 und R32

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann; bevorzugt ist der Ring Pyrrolidin, Piperidin, N-Methylpiperazin, Morpholin;

R33 ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten kann und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

APD62429PC

R12 OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R80), CON(R81)(R82), 3-12 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der ein oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, CN, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, N(R34)(R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38))<sub>t</sub>(R39), CO(C(R37)(R38))<sub>t</sub>(R39), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R40), S(O)<sub>u</sub>(R41) enthalten kann;  
 bevorzugt OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, CN, 3-10 gliedriger mono-, oder bicyclischer Ring, der 1-3 Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-10 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, CN, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, N(R34)(R35), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl enthalten kann;  
 besonders bevorzugt OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 3-10 gliedriger mono-, oder bicyclischer Ring, der 1-2 Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-10 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, OH, Oxo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl enthalten kann;

t 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

u 0, 1, 2; bevorzugt 0 oder 2; besonders bevorzugt 2;

R34, R35, R37, R38

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

R34 und R35

optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1



APD62429PC

weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;

R36, R39 unabhängig voneinander (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R40 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl;

R41 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R78, R79 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl;

R80, R81 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R3 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl; bevorzugt H;

R4, R5 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl; bevorzugt unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl; besonders bevorzugt unabhängig voneinander H, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R6, R7, R8, R9

H;

oder

R6 und R7, R8 und R9

unabhängig voneinander optional Oxo;

APD62429PC

bevorzugt sind R6, R7, R8, R9 H;

n 1

m 1 oder 2; bevorzugt 1;

A, B, D, G unabhängig voneinander N, C(R42);

oder

die Gruppen A und B oder D und G sind jeweils C(R42) und bilden gemeinsam eine ortho-Phenyleneinheit, so dass sich insgesamt ein 1,4-bisubstituiertes Naphthalinsystem ergibt;

bevorzugt sind

B N, C(R42); und A, D, G C(R42);

besonders bevorzugt sind

A, B, D, G C(R42);

R42 H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, N(R43)(R44), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), CO(R51), -(CR84R85)<sub>x</sub>-O(R86);  
bevorzugt H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), CO(R51), -(CR84R85)<sub>x</sub>-O(R86);  
besonders bevorzugt H, F, Cl, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, -(CR84R85)<sub>x</sub>-O(R86);

R43, R44, R45, R46, R47

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

R43 und R44, R45 und R46

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

APD62429PC

R48, R50, R51

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl; bevorzugt unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R84, R85 H;

R86 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

x 0, 1, 2; bevorzugt 0, 1; besonders bevorzugt 1;

R10 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

X N(R52), eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), C(R55)(R56)O, C=C, CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>, YCH<sub>2</sub>; bevorzugt N(R52), eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>; besonders bevorzugt eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>;

Y O, S, N(R89);

R89 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

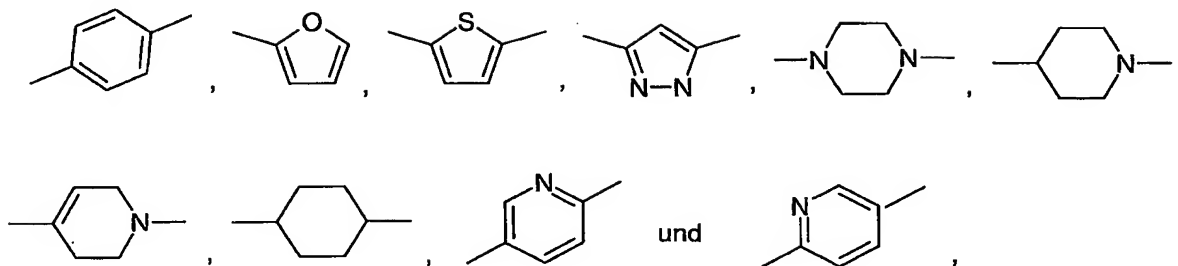
R52, R53, R54, R55, R56

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl

E 3-8 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, S-Aryl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, N(R61)CO(R62), N(R63)SO<sub>2</sub>(R64), CO(R65) tragen und mono- oder bicyclisch sein kann;  
bevorzugt 5-7 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-3 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional



APD62429PC



die optional die vorstehend genannten Substituenten tragen können;

**R57, R58, R61, R63**

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

**R62, R64, R65**

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl; bevorzugt unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

K eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C=C, C≡C, SCH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>; bevorzugt eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, N(R66), CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C≡C, SCH<sub>2</sub>; besonders bevorzugt eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C≡C;

v 1, 2, 3, 4; bevorzugt 1, 2, 3; besonders bevorzugt 1,2;

**R66, R67, R68, R69, R70**

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

**R11** H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi-, tri- oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich

APD62429PC

substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, COO(R74), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

bevorzugt (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi-, tri- oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 3 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

besonders bevorzugt (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-oder bicyclischer Ring, welcher 0 bis 2 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

R72 und R73, R76 und R77

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann; oder

deren N-Oxide sowie deren physiologisch verträgliche Salze.

In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform bedeuten A, B, G und D in Formel I CH oder:

APD62429PC

Wenn E 1,4-Phenylen bedeutet, haben A, B, G und D des Weiteren bevorzugt die in der nachfolgenden Tabelle I aufgeführten Bedeutungen:

Tabelle I:

A	B	G	D
N	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH
C-Cl	N	CH	CH
C-F	CH	C-F	CH
CH	CH	C-F	CH
CH	C-F	CH	CH
CH	CH	CH	CF
CH	C-Br	CH	CH
CH	CH	C-Br	CH
CH	C-Cl	CH	CH
CH	CH	C-Cl	CH
CH	CH	C-CN	CH

APD62429PC

CH	CH	CH	C-CN
CH	CH	C-CH <sub>3</sub>	CH
CH	CH	CH	C-CH <sub>3</sub>
CH	CH	C-CF <sub>3</sub>	CH
CH	CH	CH	C-CF <sub>3</sub>
CH	CH	CH	CH <sub>2</sub> OH
CH	C-F	CH	C-F
CH	C-F	C-F	CH
CH	CH	C-F	C-F
CH	CH	C-F	C-Cl
CH	CH	C-Cl	C-CN
CH	C-CH <sub>3</sub>	C-Cl	CH
CH	N	CH	C-CH <sub>3</sub>
CH	C-CH <sub>3</sub>	CH	N
CH	N	C-CH <sub>3</sub>	CH



APD62429PC

CH

CH



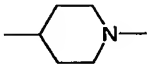
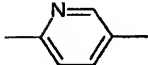
Wenn E  bedeutet, haben A, B, G und D des Weiteren bevorzugt die in der nachfolgenden Tabelle II aufgeführten Bedeutungen:

Tabelle II:

A	B	G	D
CH	C-CH <sub>3</sub>	CH	CH
CH	C-F	CH	CH
CH	CH	C-CH <sub>3</sub>	CH
CH	CH	C-F	CH
CH	N	CH	CH
CH	CH	CH	N
C-F	CH	C-F	CH

Wenn E  bedeutet, haben A, B, G und D des Weiteren bevorzugt die in der nachfolgenden Tabelle III aufgeführten Bedeutungen:

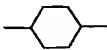



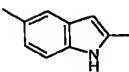
APD62429PC

Tabelle III:

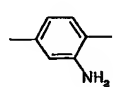
A	B	G	D
CH	CH	C-F	CH
CH	N	CH	CH
CH	CH	CH	N

In Tabelle IV sind weitere bevorzugte Kombinationen für E und A, B, G und D aufgeführt.

Tabelle IV:

E	A	B	G	D
	CH	C-F	CH	CH
	CH	CH	C-F	CH
	CH	C-F	CH	CH
	CH	C-F	CH	CH
	CH	CF	CH	CH

APD62429PC

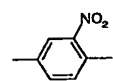


CH

CF

CH

CH

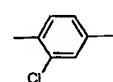


CH

C-F

CH

CH

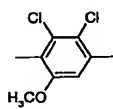


CH

C-F

CH

CH

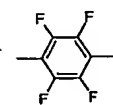


CH

C-F

CH

CH

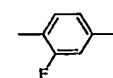


CH

C-F

CH

CH

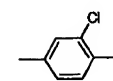


CH

C-F

CH

CH

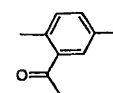


CH

C-F

CH

CH

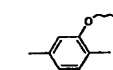


CH

C-F

CH

CH

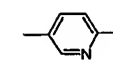


CH

C-F

CH

CH



CH

C-F

CH

CH

APD62429PC



CH

C-F

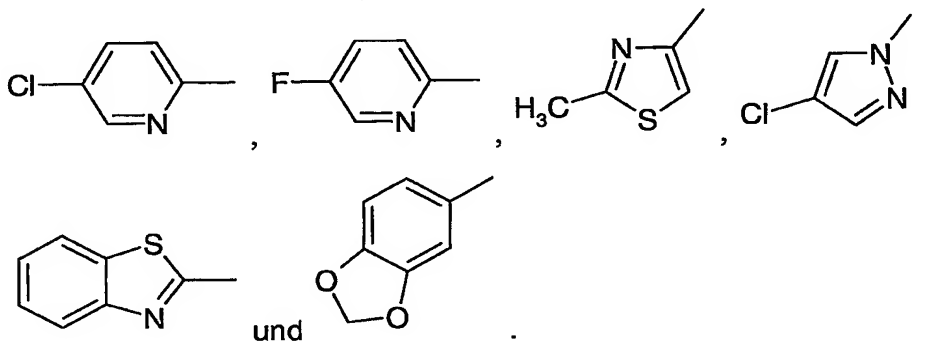
CH

CH

Die Reste R11, K, X und E in Formel I haben in einer besonders bevorzugten Ausführungsform eine der folgenden Bedeutungen:

R11 ist bevorzugt ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus:

n-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, iso-Pentyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohex-(1)-enyl, Phenyl, p-Fluorophenyl, p-Chlorophenyl, p-Bromophenyl, p-Tolyl, p-Methoxyphenyl, p-Trifluoromethylphenyl, p-Methylthiophenyl, o-Fluorophenyl, o-Chlorophenyl, o-Cyanophenyl, m-Fluorophenyl, 2,4-Difluorophenyl, 3-Fluoro-4-methylphenyl, 2-Nitro-4-methylphenyl, 2-Amino-4-methylphenyl,



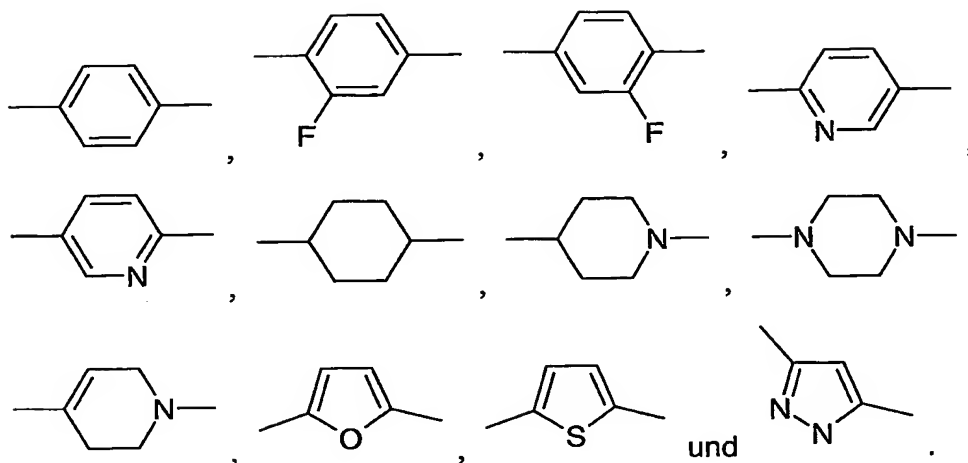
K ist bevorzugt ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus:

-O-, Bindung,  $C\equiv C$ ,  $CH_2$ ,  $CH_2O$ ,  $CONH$ ,  $OCH_2$ ,  $CO$ ,  $SCH_2$  und  $(CH_2)_2O$ .

X ist bevorzugt ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Bindung,  $NH$  und  $CH_2$ .

E ist bevorzugt ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus:

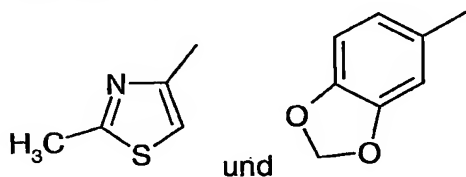
APD62429PG

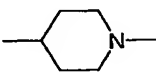


Bevorzugte Kombinationen von R11, K, X und E sind im Folgenden aufgeführt:

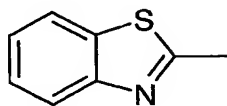
Wenn K und X jeweils eine Bindung bedeuten, haben E und R11 besonders bevorzugt die folgenden Bedeutungen:

- Wenn E 1,4-Phenylen ist, ist R11 ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus: Cyclohexyl, p-Tolyl, p-Fluorophenyl, o-Fluorophenyl, p-Methoxyphenyl, p-Chlorophenyl, o-Chlorophenyl, 2,4-Difluorophenyl, 3-Fluoro-4-methylphenyl, o-Cyanophenyl,



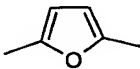
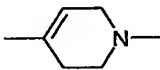
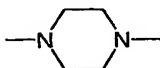
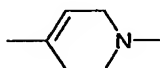
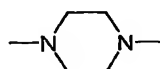
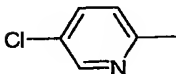
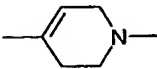
- Wenn E  ist, R11 ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus: p-Chlorophenyl, p-Tolyl, p-Fluorophenyl, p-Methoxyphenyl, p-Trifluoromethylphenyl, o-Fluorophenyl, Phenyl und

APD62429PC



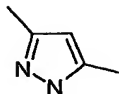
In Tabelle V sind weitere Kombinationen von E und R11 aufgeführt, für den Fall, dass K und X jeweils eine Bindung bedeuten:

Tabelle V:

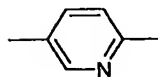
R11	E
p-Chlorophenyl	1,4-Cyclohexylen
2-Nitro-4-methylphenyl	
p-Chlorophenyl	
p-Bromophenyl	
p-Fluorophenyl	
p-Chlorophenyl	
	

APD62429PC

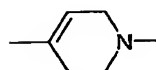
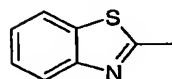
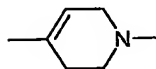
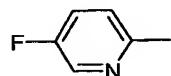
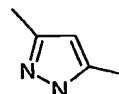
p-Tolyl



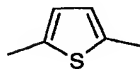
n-Butyl



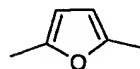
p-Chlorophenyl



p-Methylthiophenyl



2-Amino-4-methylphenyl



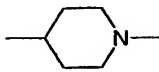
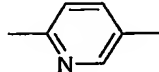
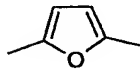
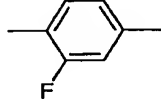
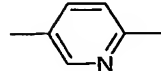
Wenn K –O– ist und X eine Bindung, NH oder CH<sub>2</sub> bedeutet, haben E und R11 besonders bevorzugt die folgenden Bedeutungen:

- Wenn E 1,4-Phenyl ist, ist R11 ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus: Phenyl, Cyclopentyl, n-Butyl, iso-Butyl, iso-Pentyl, 2,4-Difluorophenyl und p-Fluorophenyl.

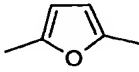
APD62429PC

In Tabelle VI sind weitere Kombinationen von E und R11 aufgeführt, für den Fall, dass K –O– ist und X eine Bindung, NH oder CH<sub>2</sub> bedeutet:

Tabelle VI:

R11	E
Phenyl	
Cyclopentyl	
Phenyl	
n-Butyl	
n-Butyl	

Wenn K C≡C ist und X eine Bindung ist, haben E und R11 besonders bevorzugt die folgenden Bedeutungen:

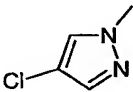
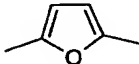
- Wenn E  ist, ist R11 ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus: Phenyl, p-Fluorophenyl und p-Chlorophenyl.



APD62429PC

Wenn K CH<sub>2</sub> ist und X eine Bindung ist, haben E und R11 besonders bevorzugt die folgenden in Tabelle VII angegebenen Bedeutungen:

Tabelle VII:

R11	E
Phenyl	1,4-Phenylen
	1,4-Phenylen
p-Chlorophenyl	

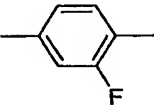
Wenn K CH<sub>2</sub>O ist und X eine Bindung ist, haben E und R11 besonders bevorzugt die folgenden Bedeutungen:

- Wenn E 1,4-Phenylen ist, ist R11 ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus: Phenyl, Cyclopropyl und Cyclohexyl.

Wenn K CONH ist und X eine Bindung ist, haben E und R11 besonders bevorzugt die folgenden in Tabelle VIII angegebenen Bedeutungen:

Tabelle VIII:

APD62429PC

R11	E
Cyclopentyl	1,4-Phenylen
Cyclohex-(1)-enyl	1,4-Phenylen
Cyclopentyl	

Wenn K OCH<sub>2</sub> ist und X eine Bindung ist, haben E und R11 besonders bevorzugt die folgenden in Tabelle IX angegebenen Bedeutungen:

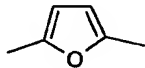
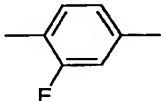
Tabelle IX:

R11	E
o-Chlorophenyl	
p-Tolyl	1,4-Phenylen
n-Propyl	1,4-Phenylen
Cyclobutyl	1,4-Phenylen

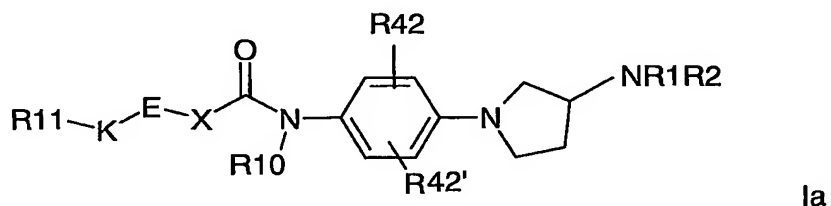
APD62429PC

Des Weiteren sind zusätzlich zu den vorstehend genannten Kombinationen die folgenden in Tabelle X aufgeführten Kombinationen von R11, K und E besonders bevorzugt, wobei X ganz besonders bevorzugt eine Bindung ist:

Tabelle X:

R11	K	E
o-Fluorophenyl	CO	
Phenyl	SCH <sub>2</sub>	1,4-Phenylene
Cyclopropyl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O	

Die Verbindungen der Formel I sind in einer ganz besonders bevorzugten Ausführungsform Verbindungen der Formel Ia



worin die Reste R1, R2, R10, R11, R42, und Gruppen X, E, K die vorstehend genannten Bedeutungen aufweisen und R42' wie R42 definiert ist, wobei R42 und R42' in den Verbindungen der Formel Ia gleich oder verschieden sein können, oder deren N-Oxide sowie deren physiologisch verträgliche Salze.

APD62429PC

In einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung weisen die Reste R1, R2, R10, R11, R42, R42' und Gruppen X, E, K die folgenden Bedeutungen auf:

R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R12, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi- oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R26), CON(R27)(R28), Hydroxy, N(R31)(R32) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>; wobei R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> nicht beide gleichzeitig CO(R26) sind,

bevorzugt H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R12, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono- oder bicyclischen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff und Stickstoff, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Oxo, CO(R26), Hydroxy, N(R31)(R32);

o 0, 1, 2, 3, 4, bevorzugt  
0, 1, 2, 3;

q 1, 2, 3, bevorzugt  
1 oder 2;

s 0, 1, 2;

APD62429PC

R15, R16, R17, R18, R23, R24, R25, R26, R27, R28, R31, R32

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

oder

R17 und R18, R27 und R28, R31 und R32

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann, bevorzugt ist der Ring ein Pyrrolidin-, Piperidin-, N-Methylpiperazin-, Morpholinring;

R12

OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 3-12 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der 1 bis 3 Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, OH, CF<sub>3</sub>, CN, Oxo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, N(R34)(R35), COO(R40), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl enthalten kann, bevorzugt OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 3-10 gliedriger mono- oder bicyclischer Ring, der 1-2 Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-10 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, OH, Oxo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl enthalten kann;

R34, R35

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl;

R40

H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl;

R78, R79

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl;

R42, R42'

unabhängig voneinander H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

R10 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

X N(R52), eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

R52, R53, R54

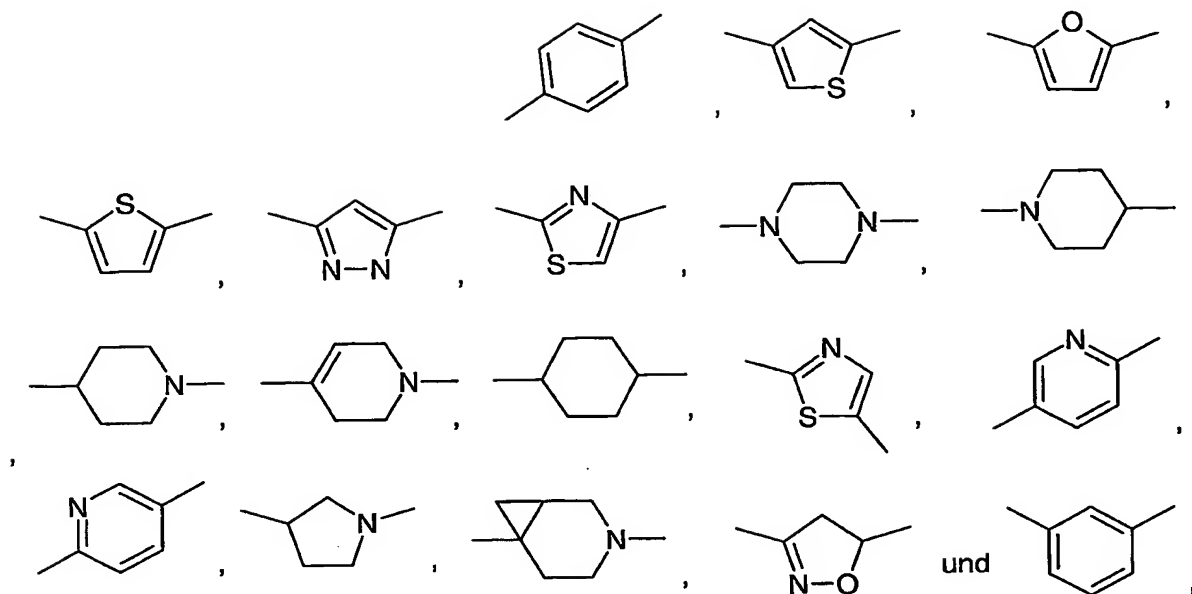
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl

E 5-7 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-3 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, OH, CN, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R65) tragen kann;

bevorzugt 5-7 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-2 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe, H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R65) tragen kann

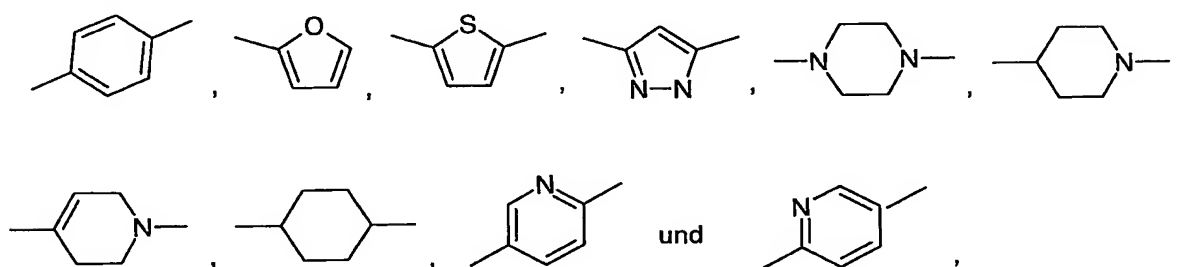
z.B. ist E ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus

APD62429PC



die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R65) tragen können;

bevorzugt



die optional die vorstehend genannten Substituenten tragen können;

R65

H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

K eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C≡C, SCH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>; bevorzugt eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, besonders bevorzugt CH<sub>2</sub>, CO, C≡C;

v 1, 2, 3, bevorzugt  
1, 2;

R66, R67, R68, R69, R70

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R11 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi-, tri- oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Oxo, CO(R71), Hydroxy, N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;  
bevorzugt (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono- oder bicyclischer Ring, welcher 0 bis 2 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

R72 und R73, R76 und R77

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem



APD62429PC

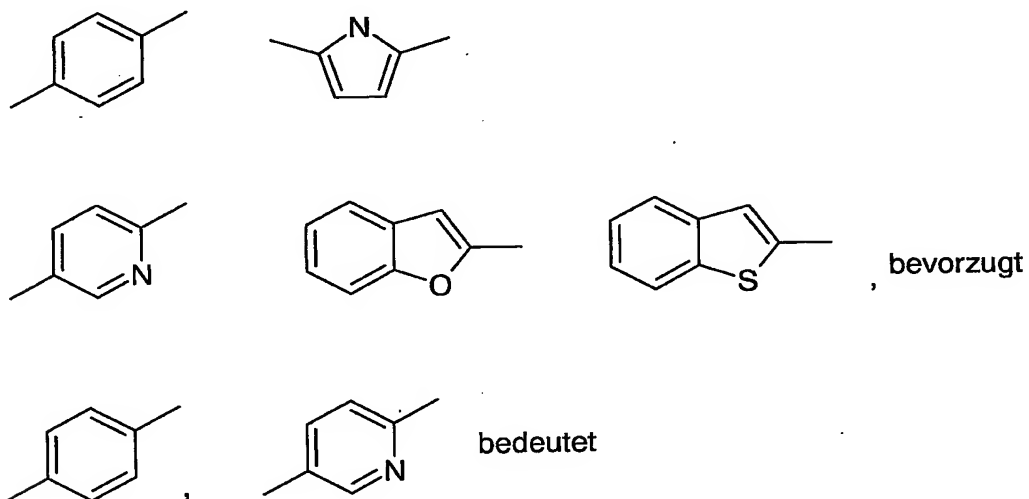
Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann.

In einer bevorzugten Ausführungsform betrifft die vorliegende Erfindung Verbindungen der Formel Ia,

worin

X CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, N(R<sub>52</sub>), CH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>, SCH<sub>2</sub>, CH=CH, bevorzugt CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH=CH bedeutet;

E



K eine Bindung, O oder C(R<sub>69</sub>)(R<sub>70</sub>) bedeutet;

und die übrigen Symbole R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>10</sub>, R<sub>11</sub>, R<sub>42</sub>, R<sub>42'</sub>, R<sub>52</sub>, R<sub>69</sub> und R<sub>70</sub> die vorstehend bezüglich der Definition der Reste der Verbindung der Formel Ia angegebenen Bedeutungen aufweisen.

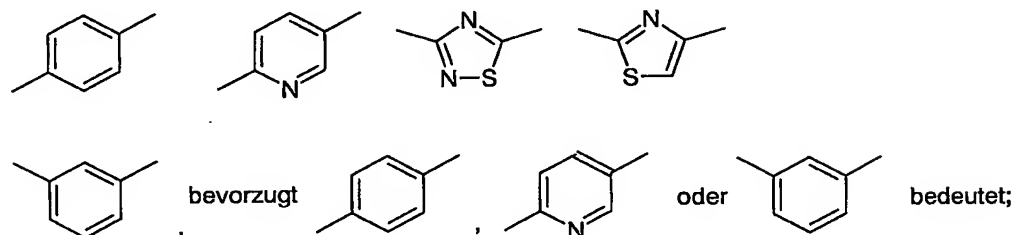
APD62429PC

In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform betrifft die vorliegende Erfindung Verbindungen der Formel Ia

worin

X N(R52), bevorzugt NH, oder C(R53)(R54) bedeutet;

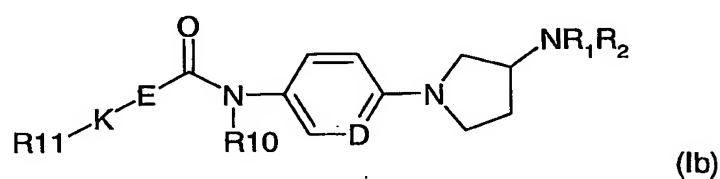
E



K eine Bindung, O oder C(R69)(R70), bevorzugt O bedeutet;  
bevorzugt O

und die übrigen Symbole R1, R2, R10, R11, R42, R42', R52, R53, R54, R69 und R70 die vorstehend bezüglich der Definition der Reste der Verbindung der Formel Ia angegebenen Bedeutungen aufweisen.

In einer weiteren besonders bevorzugten Ausführungsform sind die Verbindungen der Formel I Verbindungen der Formel Ib



APD62429PC

worin die Reste R1, R2, R10 und R11 und die Gruppen E und D die vorstehend genannten Bedeutungen aufweisen oder deren N-Oxide sowie deren physiologisch verträgliche Salze.

In einer bevorzugten Ausführungsform weisen die Reste R1, R2, R10 und R11 die Gruppen E und D die folgenden Bedeutungen auf:

R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, CO-Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, COCH=CH(R<sub>13</sub>), COCC(R<sub>14</sub>), CO(C(R<sub>15</sub>)(R<sub>16</sub>))<sub>q</sub>N(R<sub>17</sub>)(R<sub>18</sub>), CO(C(R<sub>19</sub>)(R<sub>20</sub>))<sub>r</sub>CON(R<sub>21</sub>)(R<sub>22</sub>), CO(C(R<sub>23</sub>)(R<sub>24</sub>))<sub>s</sub>O(R<sub>25</sub>); oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi- oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, CF<sub>3</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R<sub>26</sub>), CON(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>), Hydroxy, COO(R<sub>29</sub>), N(R<sub>30</sub>)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R<sub>31</sub>)(R<sub>32</sub>) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, wobei R1 und R2 nicht beide gleichzeitig CO(R<sub>26</sub>) sind;  
bevorzugt unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, COCH=CH(R<sub>13</sub>), COCC(R<sub>14</sub>), CO(C(R<sub>15</sub>)(R<sub>16</sub>))<sub>q</sub>N(R<sub>17</sub>)(R<sub>18</sub>), CO(C(R<sub>23</sub>)(R<sub>24</sub>))<sub>s</sub>O(R<sub>25</sub>); oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono- oder bicyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, CF<sub>3</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-

APD62429PC

Alkylen-Aryl, Oxo, Hydroxy, N(R31)(R32) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, wobei R1 und R2 nicht gleichzeitig CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl sind;  
 besonders bevorzugt unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -  
 (CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-  
 (CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, CO(C(R<sub>15</sub>)(R<sub>16</sub>))<sub>q</sub>N(R<sub>17</sub>)(R<sub>18</sub>), oder R1 und R2 bilden  
 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis  
 10-gliedrigen mono- oder bicyclischen Ring welcher ausser dem  
 Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann,  
 ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff und Stickstoff, wobei das  
 heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, (C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Oxo, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Hydroxy,  
 N(R<sub>31</sub>)(R<sub>32</sub>), wobei R1 und R2 nicht beide gleichzeitig CO(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl  
 sind;

o 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6; bevorzugt 0, 1, 2, 3, 4; besonders bevorzugt 0, 1, 2, 3;

q, r unabhängig voneinander 1, 2, 3; bevorzugt ist q 1 oder 2;

s 0, 1, 2, 3, 4; bevorzugt 0, 1, 2, 3; besonders bevorzugt 0, 1, 2;

R<sub>13</sub>, R<sub>14</sub> unabhängig voneinander einen Phenylring, der 0-1 Stickstoffatome  
 enthalten kann;

R<sub>15</sub>, R<sub>16</sub>, R<sub>17</sub>, R<sub>19</sub>, R<sub>20</sub>, R<sub>21</sub>, R<sub>22</sub>, R<sub>23</sub>, R<sub>24</sub>, R<sub>25</sub>, R<sub>26</sub>, R<sub>27</sub>, R<sub>28</sub>, R<sub>29</sub>, R<sub>30</sub>, R<sub>31</sub>,  
 R<sub>32</sub>  
 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R<sub>18</sub> H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(R<sub>33</sub>); bevorzugt H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl,  
 CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl; besonders bevorzugt H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

oder

R<sub>17</sub> und R<sub>18</sub>, R<sub>21</sub> und R<sub>22</sub>, R<sub>27</sub> und R<sub>28</sub>, R<sub>31</sub> und R<sub>32</sub>

APD62429PC

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann; bevorzugt ist der Ring Pyrrolidin, Piperidin, N-Methylpiperazin, Morpholin;

R33 ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten kann und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R12 OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R80), CON(R81)(R82), 3-12 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der ein oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, CN, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, N(R34)(R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R40), S(O)<sub>u</sub> (R41) enthalten kann;  
bevorzugt OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, CN, 3-10 gliedriger mono-, oder bicyclischer Ring, der 1-3 Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-10 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, CN, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, N(R34)(R35), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl enthalten kann;  
besonders bevorzugt OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 3-10 gliedriger mono-, oder bicyclischer Ring, der 1-2 Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-10 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, OH, Oxo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl enthalten kann;

t 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

APD62429PC

u 0, 1, 2; bevorzugt 0 oder 2; besonders bevorzugt 2;

R34, R35, R37, R38

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

R34 und R35

optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;

R36, R39 unabhängig voneinander (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R40 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl-aryl;

R41 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

R78, R79 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl;

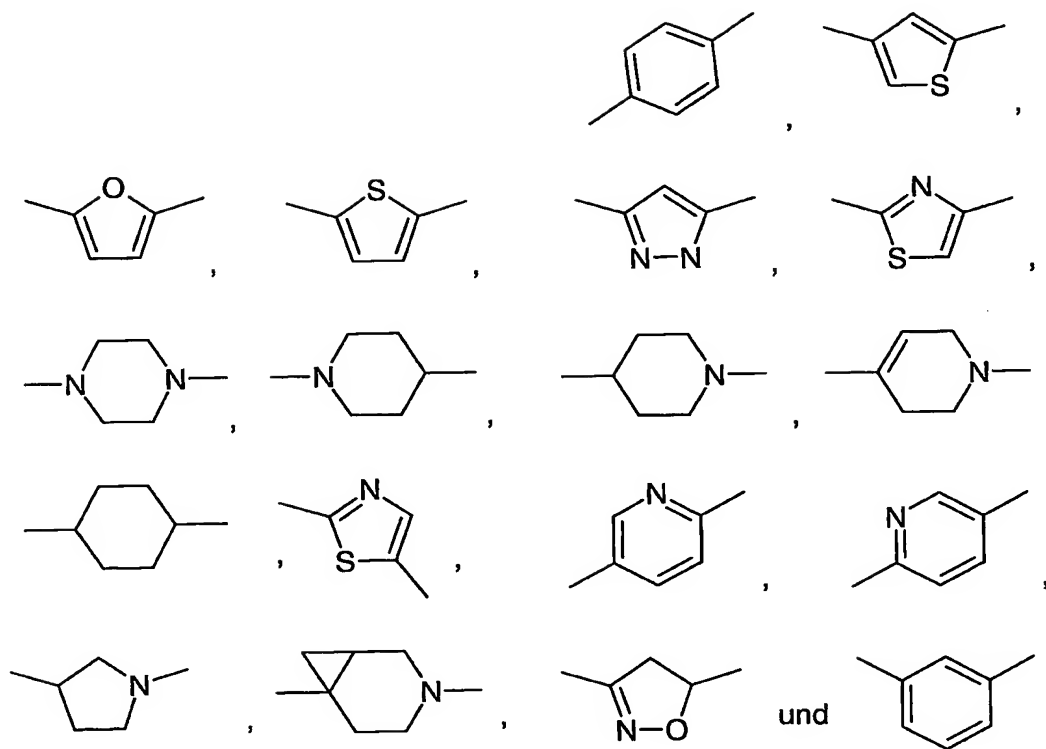
R80, R81 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R10 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

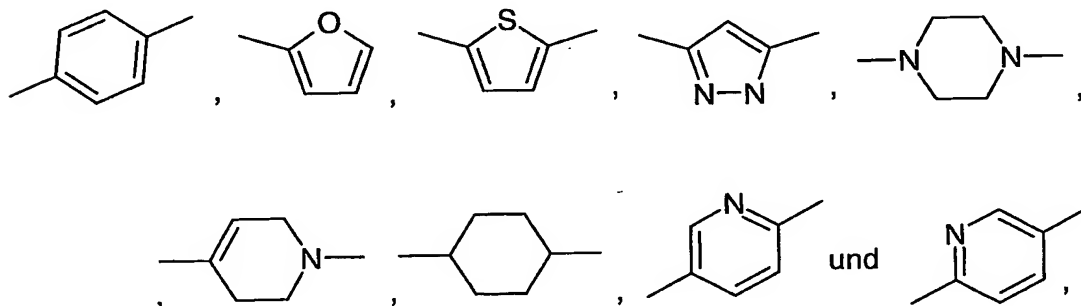
- E** 3-8 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, S-Aryl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, N(R61)CO(R62), N(R63)SO<sub>2</sub>(R64), CO(R65) tragen und mono- oder bicyclisch sein kann;  
bevorzugt 5-7 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-3 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, S-Aryl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, N(R61)CO(R62), CO(R65) tragen und mono- oder bicyclisch sein kann;  
besonders bevorzugt 5-7 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-2 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R65) tragen kann  
z.B. ist E ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus

APD62429PC



die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R65) tragen können;

bevorzugt



die optional die vorstehend genannten Substituenten tragen können;



APD62429PC

R57, R58, R61, R63

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R62, R64, R65

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl; bevorzugt unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

K

eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C=C, C≡C, SCH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;  
 bevorzugt eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, N(R66), CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C=C, SCH<sub>2</sub>; besonders bevorzugt eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C=C;

v

1, 2, 3, 4; bevorzugt 1, 2, 3; besonders bevorzugt 1,2;

R66, R67, R68, R69, R70

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R11

H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi-, tri- oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, COO(R74), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> SCF<sub>3</sub>;  
 bevorzugt (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi-, tri- oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 3 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und

APD62429PC

Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

besonders bevorzugt (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-oder bicyclischer Ring, welcher 0 bis 2 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

R72 und R73, R76 und R77

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann.

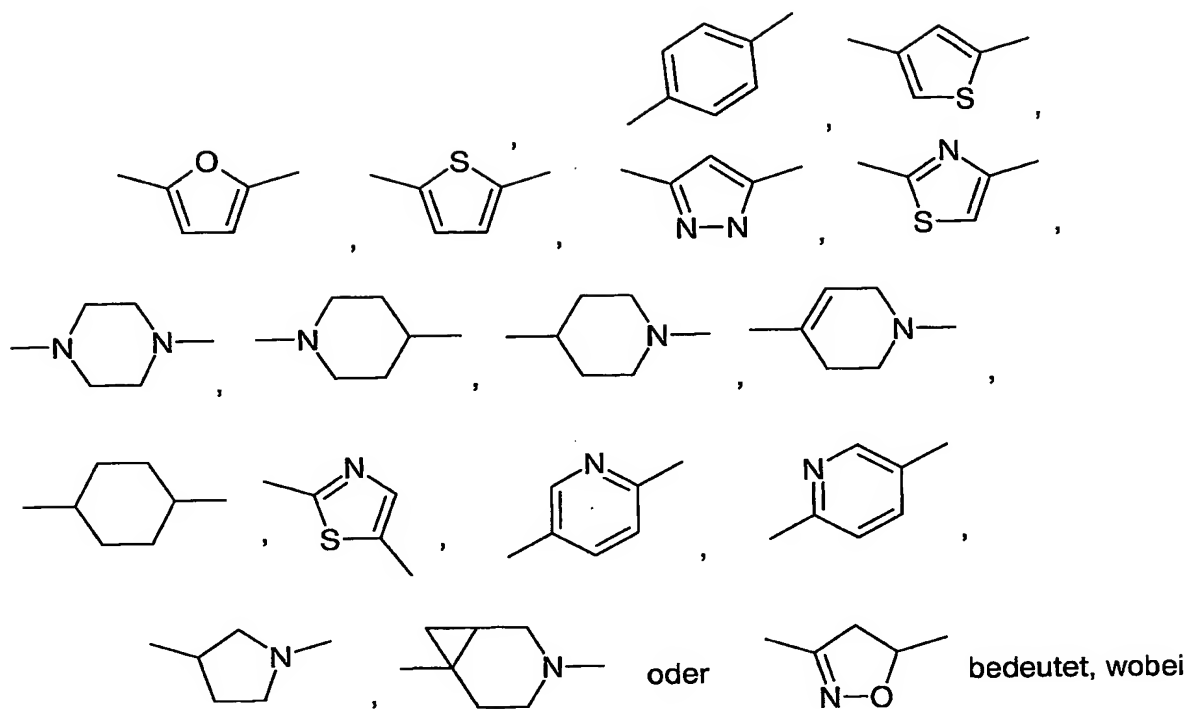
In einer bevorzugten Ausführungsform betrifft die vorliegende Erfindung Verbindungen der Formel Ib

worin

X eine Bindung bedeutet,

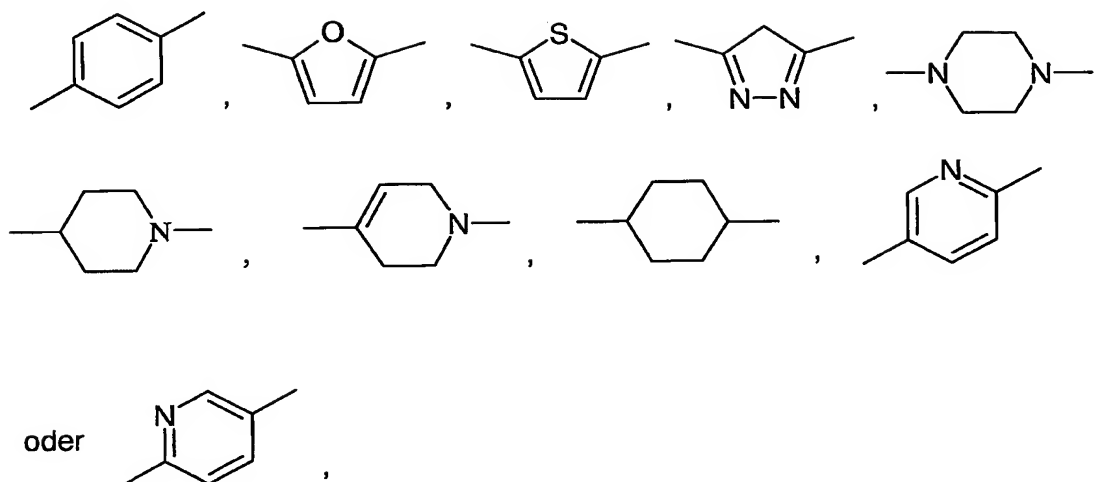
E

APD62429PC



die vorstehend genannten Gruppen optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, N(R<sub>57</sub>)(R<sub>58</sub>), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CO(R<sub>65</sub>) tragen können;  
bevorzugt bedeutet E

APD62429PC



worin die Gruppen die vorstehend genannten Substituenten tragen können;

K eine Bindung bedeutet; und

die übrigen Reste R1, R2, R10 und R11 und die Gruppe D die vorstehend bezüglich der Definition der Reste der Verbindung der Formel Ib angegebenen Bedeutungen aufweisen.

Besonders bevorzugt ist R11 in den vorstehend genannten Verbindungen der Formel Ib ein substituiertes mono- oder bicyclisches Ringsystem mit 5-10 Gliedern, das 0-3 Heteroatome, insbesondere N, O und/oder S, aufweisen kann, besonders bevorzugt Phenyl mit 0-1 N-Atom, Cyclohexyl oder ein bicyclisches System mit 8-10 Gliedern und 1-2 Heteroatomen, insbesondere N, O und/oder S.

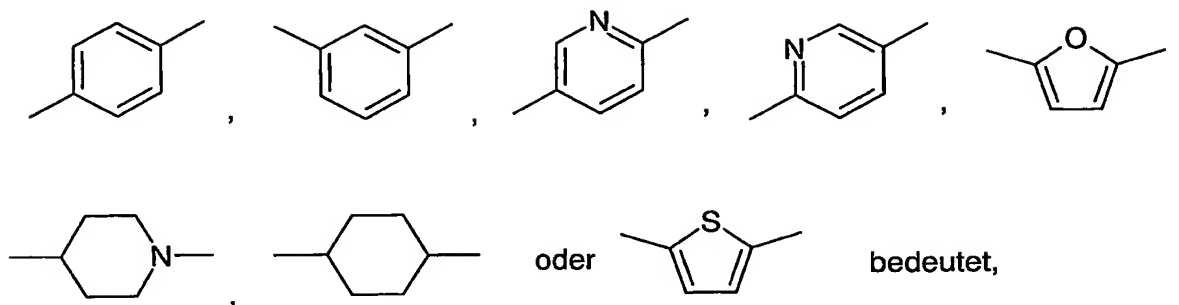
In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform betrifft die vorliegende Erfindung Verbindungen der Formel Ib

worin

X eine Bindung bedeutet;

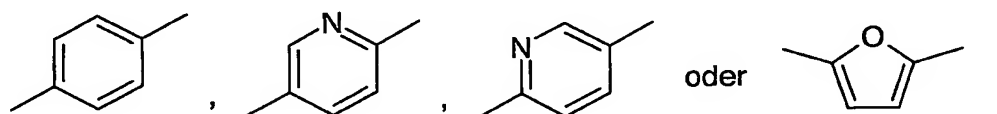
APD62429PC

E



wobei die vorstehend genannten Gruppen optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> und CO(R65) tragen können;

bevorzugt



worin die Gruppen die vorstehend genannten Substituenten tragen können;

K CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, O, CH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>, CON(R68), N(R67)CO, S, SO<sub>2</sub>, SCH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CO oder eine Dreifachbindung;  
bevorzugt CH<sub>2</sub>, O, CH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>, CON(R68), SCH<sub>2</sub>, CO oder eine Dreifachbindung; und

die übrigen Reste R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub>, R<sub>8</sub>, R<sub>9</sub>, R<sub>10</sub>, R<sub>11</sub>, R<sub>67</sub> und R<sub>68</sub> und die Gruppe D die vorstehend bezüglich der Definition der Reste der Verbindung der Formel Ib angegebenen Bedeutungen aufweisen.

APD62429PC

Die Menge einer Verbindung gemäß Formel (I), die erforderlich ist, um den gewünschten biologischen Effekt zu erreichen, ist abhängig von einer Reihe von Faktoren, z.B. der gewählten spezifischen Verbindung, der beabsichtigten Verwendung, der Art der Verabreichung und dem klinischen Zustand des Patienten. Im allgemeinen liegt die Tagesdosis im Bereich von 0,3 mg bis 100 mg (typischerweise von 3 mg bis 50 mg) pro Tag pro Kilogramm Körpergewicht, z.B. 3-10 mg/kg/Tag. Eine intravenöse Dosis kann z.B. im Bereich von 0,3 mg bis 1,0 mg/kg liegen, die geeigneterweise als Infusion von 10 ng bis 100 ng pro Kilogramm pro Minute verabreicht werden kann. Geeignete Infusionslösungen für diese Zwecke können z.B. von 0,1 ng bis 10 mg, typischerweise von 1 ng bis 10 mg pro Milliliter, enthalten. Einzeldosen können z.B. von 1 mg bis 10 g des Wirkstoffs enthalten. Somit können Ampullen für Injektionen beispielsweise von 1 mg bis 100 mg, und oral verabreichbare Einzeldosisformulierungen, wie zum Beispiel Tabletten oder Kapseln, können beispielsweise von 1,0 bis 1000 mg, typischerweise von 10 bis 600 mg enthalten. Im Falle pharmazeutisch verträglicher Salze beziehen sich die vorgenannten Gewichtsangaben auf das Gewicht der dem Salz zugrunde liegenden freien Verbindung. Zur Prophylaxe oder Therapie der oben genannten Zustände können die Verbindungen gemäß Formel (I) selbst als Verbindung verwendet werden, vorzugsweise liegen sie jedoch mit einem verträglichen Träger in Form einer pharmazeutischen Zusammensetzung vor. Der Träger muss natürlich verträglich sein, in dem Sinne, dass er mit den anderen Bestandteilen der Zusammensetzung kompatibel ist und nicht gesundheitsschädlich für den Patienten ist. Der Träger kann ein Feststoff oder eine Flüssigkeit oder beides sein und wird vorzugsweise mit der Verbindung als Einzeldosis formuliert, beispielsweise als Tablette, die von 0,05% bis 95 Gew.-% des Wirkstoffs enthalten kann. Weitere pharmazeutisch aktive Substanzen können ebenfalls vorhanden sein, einschließlich weiterer Verbindungen gemäß Formel (I). Die erfindungsgemäßen pharmazeutischen Zusammensetzungen können nach einer der bekannten pharmazeutischen Methoden hergestellt werden, die im wesentlichen darin bestehen, dass die Bestandteile mit pharmakologisch verträglichen Träger- und/oder Hilfsstoffen gemischt werden.

APD62429PC

Erfindungsgemäße pharmazeutische Zusammensetzungen sind solche, die für orale, rektale, topische, perorale (z.B. sublinguale) und parenterale (z.B. subkutane, intramuskuläre, intradermale oder intravenöse) Verabreichung geeignet sind, wenngleich die geeignetste Verabreichungsweise in jedem Einzelfall von der Art und Schwere des zu behandelnden Zustandes und von der Art der jeweils verwendeten Verbindung gemäß Formel (I) abhängig ist. Auch dragierte Formulierungen und dragierte Retardformulierungen gehören in den Rahmen der Erfindung. Bevorzugt sind säure- und magensaftresistente Formulierungen. Geeignete magensaftresistente Beschichtungen umfassen Celluloseacetatphthalat, Polyvinylacetatphthalat, Hydroxypropylmethylcellulosephthalat und anionische Polymere von Methacrylsäure und Methacrylsäuremethylester.

Geeignete pharmazeutische Verbindungen für die orale Verabreichung können in separaten Einheiten vorliegen, wie zum Beispiel Kapseln, Oblatenkapseln, Lutschtabletten oder Tabletten, die jeweils eine bestimmte Menge der Verbindung gemäß Formel (I) enthalten; als Pulver oder Granulate; als Lösung oder Suspension in einer wässrigen oder nicht-wässrigen Flüssigkeit; oder als eine Öl-in-Wasser- oder Wasser-in-Öl-Emulsion. Diese Zusammensetzungen können, wie bereits erwähnt, nach jeder geeigneten pharmazeutischen Methode zubereitet werden, die einen Schritt umfasst, bei dem der Wirkstoff und der Träger (der aus einem oder mehreren zusätzlichen Bestandteilen bestehen kann) in Kontakt gebracht werden. Im allgemeinen werden die Zusammensetzungen durch gleichmäßiges und homogenes Vermischen des Wirkstoffs mit einem flüssigen und/oder feinverteilten festen Träger hergestellt, wonach das Produkt, falls erforderlich, geformt wird. So kann beispielsweise eine Tablette hergestellt werden, indem ein Pulver oder Granulat der Verbindung verpresst oder geformt wird, gegebenenfalls mit einem oder mehreren zusätzlichen Bestandteilen. Gepresste Tabletten können durch Tablettieren der Verbindung in frei fließender Form, wie beispielsweise einem Pulver oder Granulat, gegebenenfalls gemischt mit einem Bindemittel, Gleitmittel, inertem Verdünner und/oder einem (mehreren) oberflächenaktiven/dispergierenden Mittel in einer geeigneten Maschine hergestellt werden. Geformte Tabletten können durch Formen der pulverförmigen, mit einem

APD62429PC

inerten flüssigen Verdünnungsmittel befeuchteten Verbindung in einer geeigneten Maschine hergestellt werden.

Pharmazeutische Zusammensetzungen, die für eine perorale (sublinguale) Verabreichung geeignet sind, umfassen Lutschtabletten, die eine Verbindung gemäß Formel (I) mit einem Geschmacksstoff enthalten, üblicherweise Saccharose und Gummi arabicum oder Tragant, und Pastillen, die die Verbindung in einer inerten Basis wie Gelatine und Glycerin oder Saccharose und Gummi arabicum umfassen.

Geeignete pharmazeutische Zusammensetzungen für die parenterale Verabreichung umfassen vorzugsweise sterile wässrige Zubereitungen einer Verbindung gemäß Formel (I), die vorzugsweise isotonisch mit dem Blut des vorgesehenen Empfängers sind. Diese Zubereitungen werden vorzugsweise intravenös verabreicht, wenngleich die Verabreichung auch subkutan, intramuskulär oder intradermal als Injektion erfolgen kann. Diese Zubereitungen können vorzugsweise hergestellt werden, indem die Verbindung mit Wasser gemischt wird und die erhaltene Lösung steril und mit dem Blut isotonisch gemacht wird. Injizierbare erfindungsgemäße Zusammensetzungen enthalten im allgemeinen von 0,1 bis 5 Gew.-% der aktiven Verbindung.

Geeignete pharmazeutische Zusammensetzungen für die rektale Verabreichung liegen vorzugsweise als Einzeldosis-Zäpfchen vor. Diese können hergestellt werden, indem man eine Verbindung gemäß Formel (I) mit einem oder mehreren herkömmlichen festen Trägern, beispielsweise Kakaobutter, mischt und das entstehende Gemisch in Form bringt.

Geeignete pharmazeutische Zusammensetzungen für die topische Anwendung auf der Haut liegen vorzugsweise als Salbe, Creme, Lotion, Paste, Spray, Aerosol oder Öl vor. Als Träger können Vaseline, Lanolin, Polyethylenglycole, Alkohole und Kombinationen von zwei oder mehreren dieser Substanzen verwendet werden. Der Wirkstoff ist im allgemeinen in einer Konzentration von 0,1 bis 15 Gew.-% der Zusammensetzung vorhanden, beispielsweise von 0,5 bis 2%.



APD62429PC

Auch eine transdermale Verabreichung ist möglich. Geeignete pharmazeutische Zusammensetzungen für transdermale Anwendungen können als einzelne Pflaster vorliegen, die für einen langzeitigen engen Kontakt mit der Epidermis des Patienten geeignet sind. Solche Pflaster enthalten geeigneterweise den Wirkstoff in einer gegebenenfalls gepufferten wässrigen Lösung, gelöst und/oder dispergiert in einem Haftmittel oder dispergiert in einem Polymer. Eine geeignete Wirkstoff-Konzentration beträgt ca. 1% bis 35%, vorzugsweise ca. 3% bis 15%. Als eine besondere Möglichkeit kann der Wirkstoff, wie beispielsweise in Pharmaceutical Research, 2(6): 318 (1986) beschrieben, durch Elektrotransport oder Iontophorese freigesetzt werden.

Die Verbindungen der Formel I zeichnen sich durch günstige Wirkungen auf den Fettstoffwechsel aus, insbesondere sind sie zur Gewichtsreduktion und nach erfolgter Gewichtsreduktion zum Erhalt eines reduzierten Gewichtes bei Säugetieren und als Anorektika geeignet. Die Verbindungen zeichnen sich durch ihre geringe Toxizität und ihre geringen Nebenwirkungen aus.

Die Verbindungen können allein oder in Kombination mit weiteren gewichtsreduzierenden oder anorektischen Wirkstoffen eingesetzt werden. Solche weiteren anorektischen Wirkstoffe werden z.B. in der Roten Liste, Kapitel 01 unter Abmagerungsmittel/Appetitzügler genannt und können auch solche Wirkstoffe beinhalten, die den Energieumsatz des Organismus erhöhen und damit zu einer Gewichtsreduktion führen oder auch solche, welche den allgemeinen Metabolismus des Organismus so beeinflussen, dass eine erhöhte Kalorienzufuhr nicht zu einer Vergrößerung der Fettdepots und eine normale Kalorienzufuhr zu einer Verringerung der Fettdepots des Organismus führt. Die Verbindungen eignen sich zur Prophylaxe sowie insbesondere zur Behandlung von Übergewicht oder Obesitas. Die Verbindungen eignen sich weiterhin zur Prophylaxe sowie insbesondere zur Behandlung von Typ II Diabetes, der Arteriosklerose sowie zur Normalisierung des Lipidstoffwechsels und zur Behandlung des Bluthochdrucks. Die Verbindungen wirken als MCH Antagonisten und eignen sich auch zur Behandlung von Störungen des Empfindens und anderer

APD62429PC

psychiatrischen Indikationen, wie zum Beispiel Depressionen, Angstzuständen, Angstneurosen, Schizophrenie sowie zur Behandlung von Störungen assoziiert mit dem zirkadianen Rhythmus und zur Behandlung von Drogenmissbrauch.

Bei einem weiteren Aspekt der Erfindung können die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einer oder mehreren weiteren pharmakologisch wirksamen Substanzen verabreicht werden, die beispielsweise ausgewählt sind aus Antidiabetika, Antiadiposita, blutdrucksenkenden Wirkstoffen, Lipidsenkern und Wirkstoffen zur Behandlung und/oder Prävention von Komplikationen, die von Diabetes verursacht werden oder mit Diabetes assoziiert sind.

Als weitere pharmakologisch wirksame Substanzen sind insbesondere geeignet:

Alle Antidiabetika, die in der Roten Liste 2001, Kapitel 12 genannt sind. Sie können mit den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I insbesondere zur synergistischen Wirkungsverbesserung kombiniert werden. Die Verabreichung der Wirkstoffkombination kann entweder durch getrennte Gabe der Wirkstoffe an den Patienten oder in Form von Kombinationspräparaten, worin mehrere Wirkstoffe in einer pharmazeutischen Zubereitung vorliegen, erfolgen. Die meisten der nachfolgend aufgeführten Wirkstoffe sind in USP Dictionary of USAN and International Drug Names, US Pharmacopeia, Rockville 2001, offenbart.

Geeignete Antidiabetika umfassen Insulin und Insulinderivate, wie z.B. Lantus® oder HMR 1964, schnell wirkende Insuline (siehe US 6,221,633), Amylin, GLP-1- und GLP-2-Derivate wie z.B. diejenigen die in WO 98/08871 von Novo Nordisk A/S offenbart wurden, sowie oral wirksame hypoglykämische Wirkstoffe.

Die oral wirksamen hypoglykämischen Wirkstoffe umfassen vorzugsweise Sulphonylharnstoffe, Biguanidine, Meglitinide, Oxadiazolidindione, Thiazolidindione, Glukosidase-Inhibitoren, Glukagon-Rezeptor-Antagonisten, GLP-1-Agonisten,

APD62429PC

Kaliumkanalöffner wie z.B. diejenigen, die in WO 97/26265 und WO 99/03861 von Novo Nordisk A/S offenbart wurden, Insulin-Sensitizer, Aktivatoren der Insulin Rezeptor Kinase, Inhibitoren von Leberenzymen, die an der Stimulation der Glukoneogenese und/oder Glykogenolyse beteiligt sind, z.B. Inhibitoren der Glycogenphosphorylase, Modulatoren der Glukoseaufnahme und Glukoseausscheidung, den Fettstoffwechsel verändernde Verbindungen wie antihyperlipidämische Wirkstoffe und antilipidämische Wirkstoffe, z.B. HMGCoA-Reduktase-Inhibitoren, Inhibitoren des Cholesteroltransports/der Cholesterolaufnahme, Inhibitoren der Gallensäurerückresorption oder Inhibitoren des mikrosomalen Triglycerid-Transfer Proteins (MTP), Verbindungen, die die Nahrungsmiteleinnahme verringern, PPAR- und RXR-Agonisten und Wirkstoffe, die auf den ATP-abhängigen Kaliumkanal der Betazellen wirken.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die vorliegenden Verbindungen in Kombination mit Insulin verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem HMGCoA-Reduktase Inhibitor wie Simvastatin, Fluvastatin, Pravastatin, Lovastatin, Atorvastatin, Cerivastatin, Rosuvastatin verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Cholesterinresorptionsinhibitor, wie z.B. Ezetimibe, Tiqueside, Pamaqueside, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem PPAR gamma Agonist, wie z.B. Rosiglitazon, Pioglitazon, JTT-501, GI 262570, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit PPAR alpha Agonist, wie z.B. GW 9578, GW 7647, verabreicht.

APD62429PC

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem gemischten PPAR alpha/gamma Agonisten, wie z.B. GW 1536, AVE 8042, AVE 8134, AVE 0847, oder wie in PCT/US 11833, PCT/US 11490, DE10142734.4 beschrieben verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Fibrat, wie z.B. Fenofibrat, Clofibrat, Bezafibrat, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem MTP-Inhibitor, wie z.B. Implitapide, BMS-201038, R-103757, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit Gallensäureresorptionsinhibitor (siehe z.B. US 6,245,744 oder US 6,221,897), wie z.B. HMR 1741, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem CETP-Inhibitor, wie z.B. JTT-705, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem polymeren Gallensäureadsorber, wie z.B. Cholestyramin, Colesevelam, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem LDL-Rezeptorinducer (siehe US 6,342,512), wie z.B. HMR1171, HMR1586, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem ACAT-Inhibitor, wie z.B. Avasimibe, verabreicht.

APD62429PC

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Antioxidans, wie z.B. OPC-14117, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Lipoprotein-Lipase Inhibitor, wie z.B. NO-1886, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem ATP-Citrat-Lyase Inhibitor, wie z.B. SB-204990, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Squalen Synthetase Inhibitor, wie z.B. BMS-188494, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Lipoprotein(a) antagonist, wie z.B. CI-1027 oder Nicotinsäure, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Lipase Inhibitor, wie z.B. Orlistat, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit Insulin verabreicht.

Bei einer Ausführungsform werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Sulphonylharnstoff, wie z.B. Tolbutamid, Glibenclamid, Glipizid oder Glimepirid verabreicht.

Bei einer Ausführungsform werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Biguanid, wie z.B. Metformin, verabreicht.

Bei wieder einer Ausführungsform werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Meglitinid, wie z.B. Repaglinid, verabreicht.

APD62429PC

Bei einer Ausführungsform werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Thiazolidindion, wie z.B. Troglitazon, Ciglitazon, Pioglitazon, Rosiglitazon oder den in WO 97/41097 von Dr. Reddy's Research Foundation offenbarten Verbindungen, insbesondere 5-[[4-[(3,4-Dihydro-3-methyl-4-oxo-2-chinazolinylmethoxy)phenyl]methyl]-2,4-thiazolidindion, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem  $\alpha$ -Glukosidase-Inhibitor, wie z.B. Miglitol oder Acarbose, verabreicht.

Bei einer Ausführungsform werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit einem Wirkstoff verabreicht, der auf den ATP-abhängigen Kaliumkanal der Betazellen wirkt, wie z.B. Tolbutamid, Glibenclamid, Glipizid, Glimepirid oder Repaglinid.

Bei einer Ausführungsform werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit mehr als einer der vorstehend genannten Verbindungen, z.B. in Kombination mit einem Sulphonylharnstoff und Metformin, einem Sulphonylharnstoff und Acarbose, Repaglinid und Metformin, Insulin und einem Sulphonylharnstoff, Insulin und Metformin, Insulin und Troglitazon, Insulin und Lovastatin, etc. verabreicht.

Weiterhin können die erfindungsgemäßen Verbindungen in Kombination mit einem oder mehreren Antiadiposita oder appetitregulierenden Wirkstoffen verabreicht werden.

Bei einer weiteren Ausführungsform werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit CART-Modulatoren (siehe "Cocaine-amphetamine-regulated transcript influences energy metabolism, anxiety and gastric emptying in mice" Asakawa, A, et al., M.:Hormone and Metabolic Research (2001), 33(9), 554-558), NPY-Antagonisten z.B. Naphthalin-1-sulfonsäure {4-[(4-amino-quinazolin-2-ylamino)-methyl]-cyclohexylmethyl}-amid; hydrochlorid (CGP 71683A)), MC4-Agonisten (z.B. 1-Amino-1,2,3,4-tetrahydro-naphthalin-2-carbonsäure [2-(3a-benzyl-2-methyl-3-oxo- 2,3,3a,4,6,7-hexahydro-pyrazolo[4,3-c]pyridin-5-yl)-1-(4-chloro-phenyl)-2-oxo-ethyl]- amid; (WO 01/91752)) , Orexin-Antagonisten (z.B. 1-(2-Methyl-benzoxazol-6-yl)-3-[1,5]naphthyridin-4-yl-harnstoff; hydrochloride (SB-334867-A)), H3-Agonisten (3-Cyclohexyl-1-(4,4-dimethyl-

APD62429PC

1,4,6,7-tetrahydro-imidazo[4,5-c]pyridin-5-yl)-propan-1-on Oxalsäuresalz (WO 00 / 63208)); TNF-Agonisten, CRF-Antagonisten (z.B. [2-Methyl-9-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-9H-1,3,9-triaza-fluoren-4-yl]-dipropyl-amin (WO 00/66585)), CRF BP-Antagonisten (z.B. Urocortin), Urocortin-Agonisten,  $\beta$ 3-Agonisten (z.B. 1-(4-Chloro-3-methanesulfonylmethyl-phenyl)-2-[2-(2,3-dimethyl-1H-indol-6-yloxy)-ethylamino]-ethanol; hydrochloride (WO 01/83451)), MSH (Melanocyt-stimulierendes Hormon)-Agonisten, CCK-A Agonisten (z.B. {2-[4-(4-Chloro-2,5-dimethoxy-phenyl)-5-(2-cyclohexyl-ethyl)-thiazol-2-ylcarbamoyl]-5,7-dimethyl-indol-1-yl}-acetic acid Trifluoressigsäuresalz (WO 99/15525)); Serotonin-Wiederaufnahme-Inhibitoren (z.B. Dexfenfluramine), gemischte Sertonin- und noradrenerge Verbindungen (z.B. WO 00/71549), 5HT-Agonisten z.B. 1-(3-Ethyl-benzofuran-7-yl)-piperazin Oxalsäuresalz (WO 01/09111), Bombesin-Agonisten, Galanin-Antagonisten, Wachstumshormon (z.B. humanes Wachstumshormon), Wachstumshormon freisetzende Verbindungen (6-Benzyloxy-1-(2-diisopropylamino-ethylcarbamoyl)-3,4-dihydro-1H-isoquinoline-2-carboxylic acid tert-butyl ester (WO 01/85695)), TRH-Agonisten (siehe z.B. EP 0 462 884) entkoppelnde Protein 2- oder 3-Modulatoren, Leptinagonisten (siehe z.B. Lee, Daniel W.; Leinung, Matthew C.; Rozhavskaya-Arena, Marina; Grasso, Patricia. Leptin agonists as a potential approach to the treatment of obesity. *Drugs of the Future* (2001), 26(9), 873-881), DA-Agonisten (Bromocriptin, Doprexin), Lipase/Amylase-Inhibitoren (z.B. WO 00/40569), PPAR-Modulatoren (z.B. WO 00/78312), RXR-Modulatoren oder TR- $\beta$ -Agonisten verabreicht.

Bei einer Ausführungsform der Erfindung ist der weitere Wirkstoff Leptin; siehe z.B. "Perspectives in the therapeutic use of leptin", Salvador, Javier; Gomez-Ambrosi, Javier; Fruhbeck, Gema, *Expert Opinion on Pharmacotherapy* (2001), 2(10), 1615-1622.

Bei einer Ausführungsform ist der weitere Wirkstoff Dexamphatamin oder Amphetamin.

Bei einer Ausführungsform ist der weitere Wirkstoff Fenfluramin oder Dexfenfluramin.

APD62429PC

Bei noch einer Ausführungsform ist der weitere Wirkstoff Sibutramin oder die mono- und bisdemethylierten Wirkmetabolite von Sibutramin.

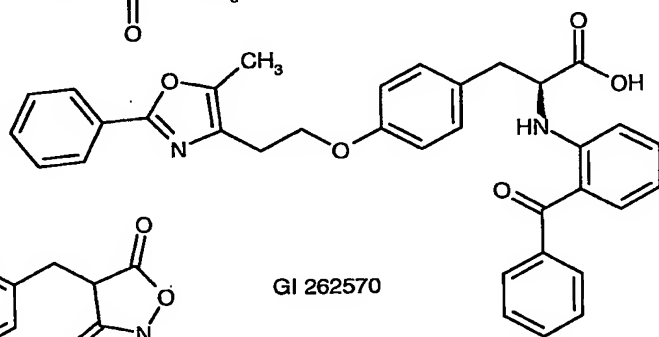
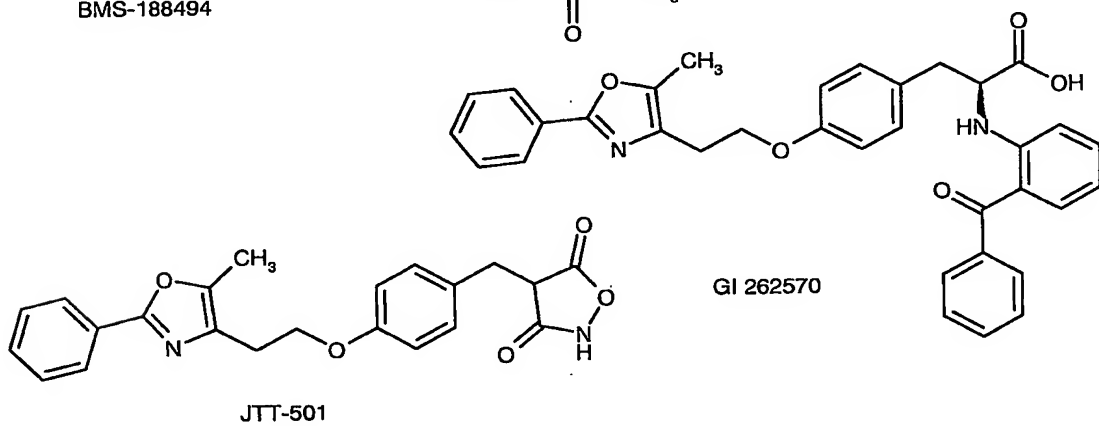
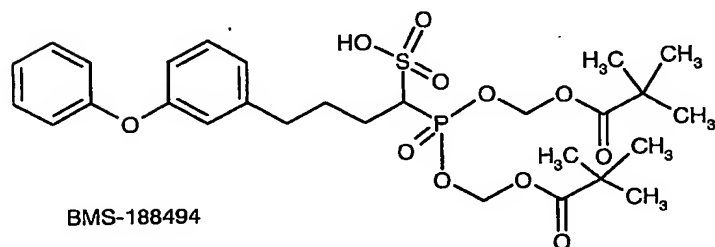
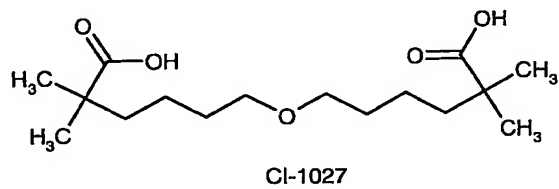
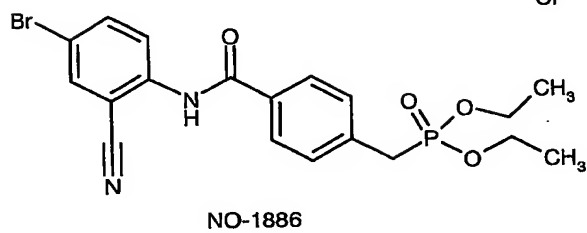
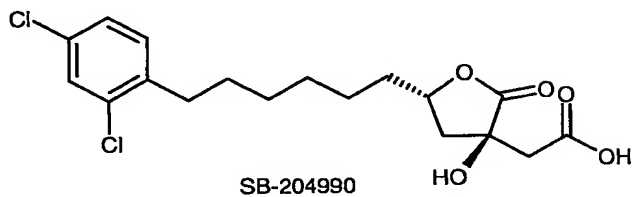
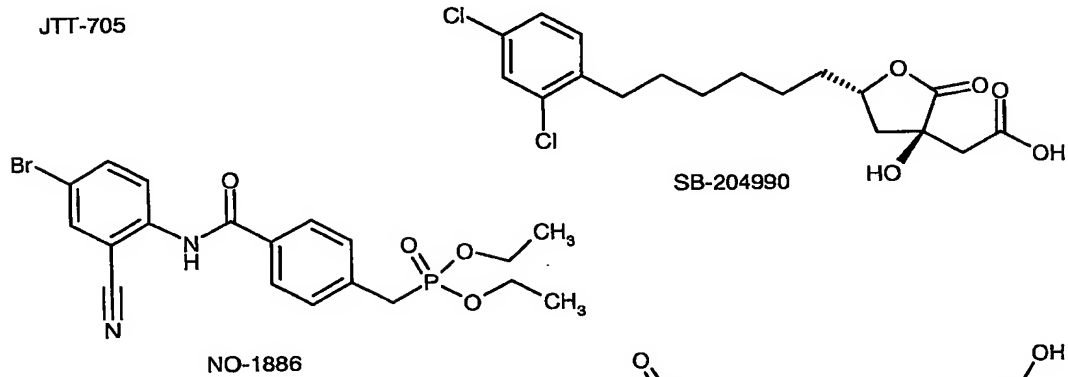
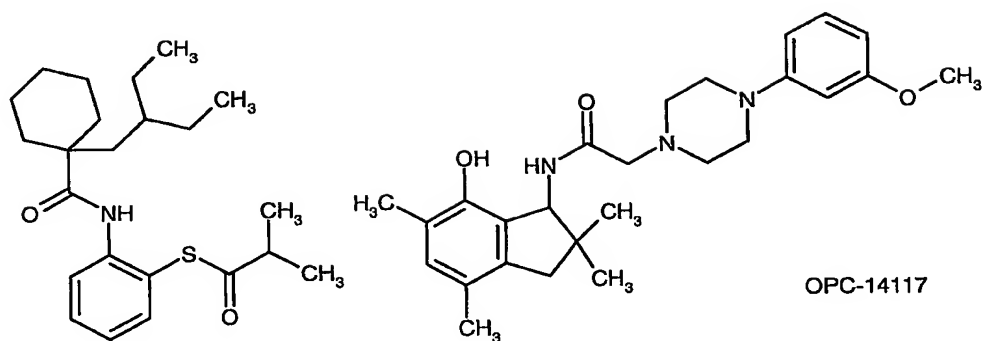
Bei einer Ausführungsform ist der weitere Wirkstoff Orlistat.

Bei einer Ausführungsform ist der weitere Wirkstoff Mazindol oder Phentermin.

Bei einer Ausführungsform werden die Verbindungen der Formel I in Kombination mit Ballaststoffen, vorzugsweise unlöslichen Ballaststoffen (siehe z.B. Carob/ Caromax<sup>®</sup> (Zunft H J; et al., Carob pulp preparation for treatment of hypercholesterolemia, ADVANCES IN THERAPY (2001 Sep-Oct), 18(5), 230-6.) Caromax ist ein Carob enthaltendes Produkt der Fa. Nutrinova, Nutrition Specialties & Food Ingredients GmbH, Industriepark Höchst, 65926 Frankfurt / Main)) verabreicht. Die Kombination mit Caromax<sup>®</sup> kann in einer Zubereitung erfolgen, oder durch getrennte Gabe von Verbindungen der Formel I und Caromax<sup>®</sup>. Caromax<sup>®</sup> kann dabei auch in Form von Lebensmitteln, wie z.B. in Backwaren oder Müsliriegeln, verabreicht werden.



APD62429PC



APD62429PC

Weiterhin können die vorliegenden Verbindungen in Kombination mit einem oder mehreren antihypertensiven Wirkstoffen verabreicht werden. Beispiele für antihypertensive Wirkstoffe sind Betablocker wie Alprenolol, Atenol, Timolol, Pindolol, Propanolol und Metoprolol, ACE (Angiotensin Converting Enzym)-Hemmer wie z.B. Benazepril, Captopril, Enalapril, Fosinopril, Lisinopril, Quinapril und Rampril, Calciumkanal-Blocker wie Nifedipin, Felodipin, Nicardipin, Isradipin, Nimodipin, Diltiazem und Verapamil, sowie Alphablocker wie Doxazosin, Urapidil, Prazosin und Terazosin. Weiterhin kann verwiesen werden auf Remington: The Science and Practice of Pharmacy, 19. Auflage, Gennaro, Hrsg., Mack Publishing Co., Easton, PA, 1995.

Es versteht sich, dass jede geeignete Kombination der erfindungsgemäßen Verbindungen mit einer oder mehreren der vorstehend genannten Verbindungen und wahlweise einer oder mehreren weiteren pharmakologisch wirksamen Substanzen als unter den Schutzbereich der vorliegenden Erfindung fallend angesehen wird.

### **Beispiele**

Die Wirksamkeit der Verbindungen wurde wie folgt getestet:

Biologisches Prüfmodell:

Die Prüfung der anorektischen Wirkung erfolgte an weiblichen NMRI Mäusen. Nach 17stündigem Futterentzug wurde über eine Schlundsonde das Testpräparat verabreicht. In Einzelhaltung und bei freiem Zugang zu Trinkwasser wurde den Tieren 30 Minuten nach Präparatgabe Kondensmilch angeboten. Der Kondensmilchverbrauch wurde halbstündlich 7 Stunden lang bestimmt und das Allgemeinbefinden der Tiere beobachtet. Der gemessene Milchverbrauch wurde mit den Vehikel-behandelten Kontrolltieren verglichen.

APD62429PC

Tabelle 1: Anorektische Wirkung, gemessen als Reduktion des kumulierten Milchkonsums behandelter im Vergleich zu Kontrolltieren.

Beispiel	Orale Dosis [mg/kg]	Anzahl der Tiere / Kumulierter Milchkonsum der behandelten Tiere N / [mL]	Anzahl der Tiere / Kumulierter Milchkonsum der Kontrolltiere N / [mL]	Reduktion des kumulierten Milchkonsums in % der Kontrolle
Beispiel 4	30	5 /3,55	5/1,76	50
Beispiel 13	30	5/3,70	5/1,34	64

## VERSUCHSBESCHREIBUNG

### Funktionelle Messungen zur Ermittlung von IC50-Werten

Die Klonierung der cDNA für den humanen MCH-Rezeptor, Herstellung einer rekombinanten HEK293-Zelllinie, welche den humanen MCH-Rezeptor exprimiert, sowie funktionelle Messungen mit der rekombinanten Zelllinie erfolgten sinngemäß wie von Audinot et al. (J. Biol. Chem. 276, 13554-13562, 2001) beschrieben. Im Unterschied zur Literaturstelle wurde jedoch für die Konstruktion des Expressionsvektors das Plasmid pEAK8 der Fa. EDGE Biosystems (USA) verwendet. Als Wirt für die Transfektion diente

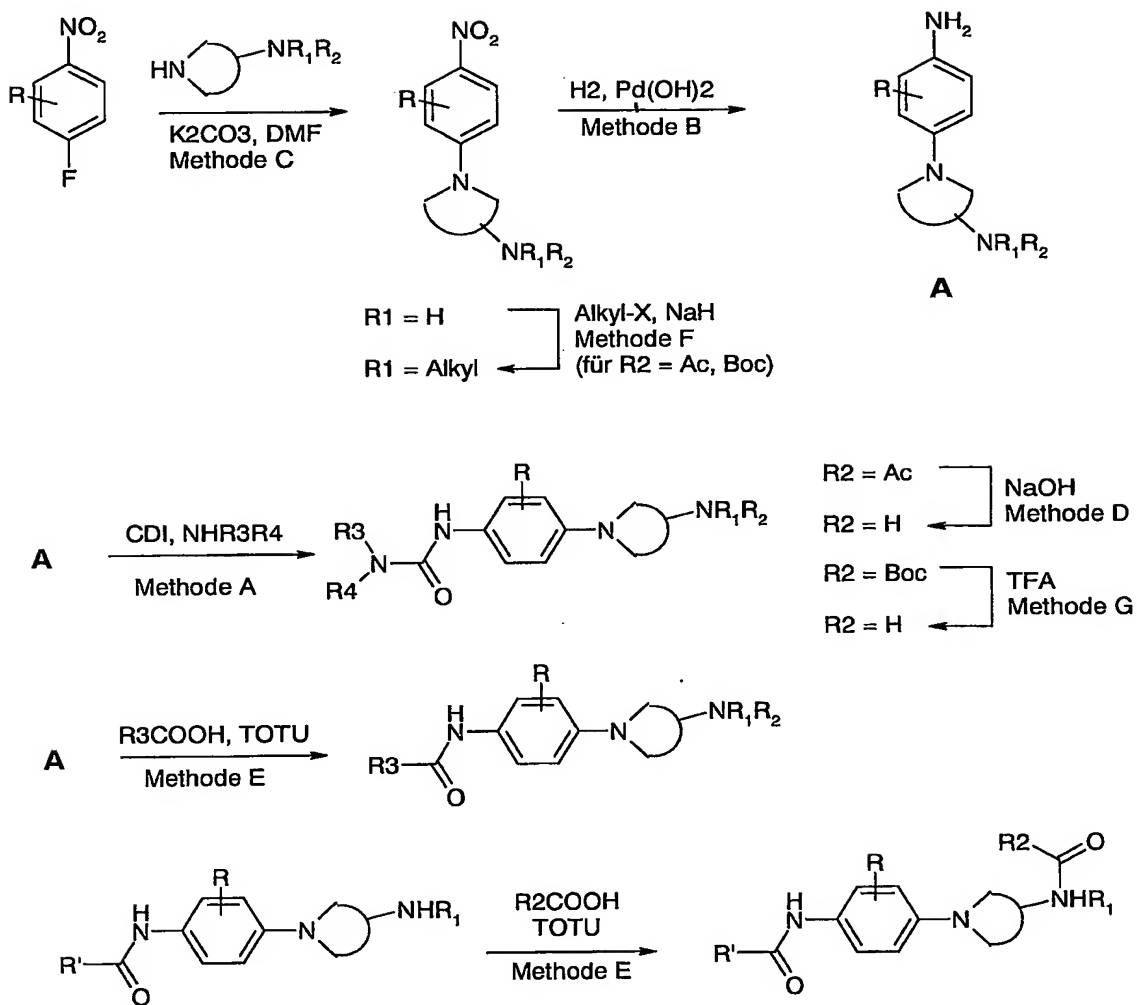
APD62429PC

eine transformierte HEK-Zelllinie namens „PEAK Stable Cells“ (ebenfalls von EDGE Biosystems). Die funktionellen Messungen des zellulären Calciumflusses nach Agonistenzugabe (MCH) in Gegenwart von erfindungsgemäßigem Ligand erfolgten mit Hilfe des FLIPR-Gerätes der Fa. Molecular Devices (USA), unter Verwendung von Vorschriften des Geräteherstellers.

Die nachfolgend aufgeführten Beispiele und Herstellungsmethoden dienen zur Erläuterung der Erfindung, ohne diese jedoch einzuschränken.

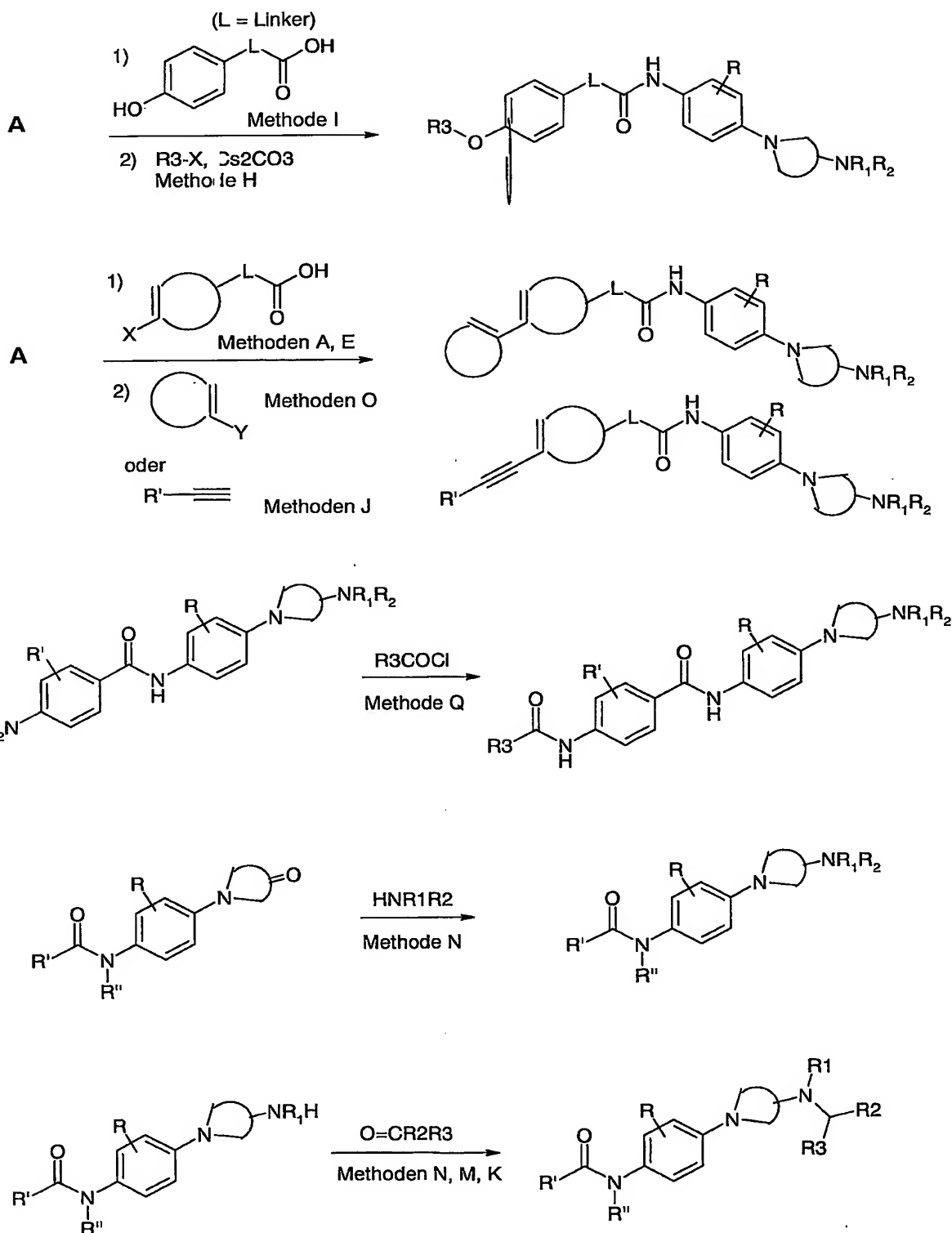
Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I können mit Hilfe von im Prinzip bekannten Reaktionen hergestellt werden. Beispielsweise wurden die Verbindungen nach folgenden allgemeinen Reaktionsschemata erhalten.

APD62429PC



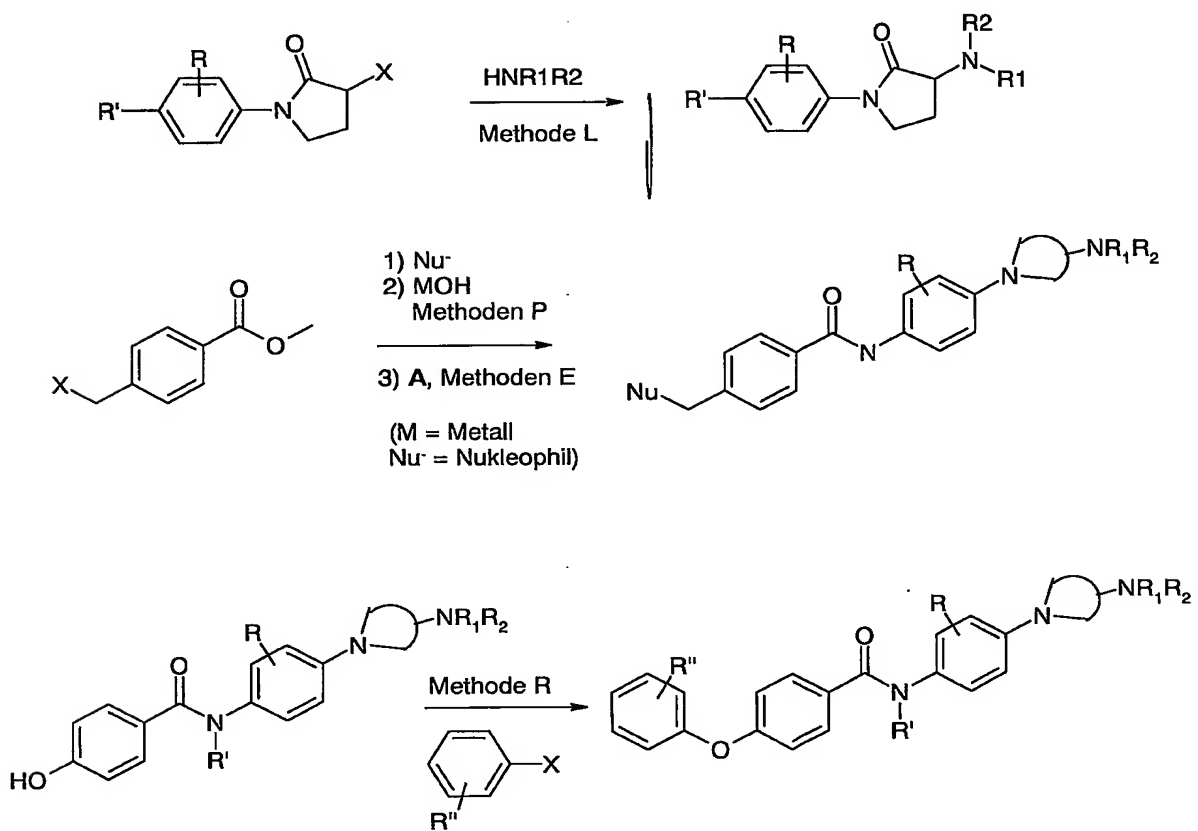
Andere erfindungsgemäße Verbindungen können auf weiteren Wegen erhalten werden, die im folgenden Schema beispielhaft skizziert sind.

APD62429PC



APD62429PC

Wieder andere Beispiele wurden erhalten wie im folgenden Schema angedeutet.



Beschreibungen der verwendeten allgemeinen Methoden finden sich exemplarisch an folgenden Stellen beschrieben:

Methode A, B und C im Beispiel 1;

Methode D im Beispiel 2;

APD62429PC

Methode E im Beispiel 3;

Methode E-a im Beispiel 275;

Methode E-b im Beispiel 286;

Methode F im Beispiel 4;

Methode F-a im Beispiel 264;

Methode G im Beispiel 15;

Methode H im Beispiel 237;

Methode H-a im Beispiel 298;

Methode I im Beispiel 238;

Methode J im Beispiel 245;

Methode J-a im Beispiel 297;

Methode K im Beispiel 250;

Methode L im Beispiel 254;

Methode M im Beispiel 274;

Methode N im Beispiel 277;

Methode O im Beispiel 279;

Methode O-a im Beispiel 292;

Methode O-b im Beispiel 280;

Methode P im Beispiel 285;



APD62429PC

Methode Q im Beispiel 290;

Methode R im Beispiel 309.

### Allgemeine Erläuterungen

#### a) Zeichenweise der Strukturformeln

In den Strukturformeln der gegebenen Beispiele sind zur Übersichtlichkeit nur Nicht-Wasserstoffatome dargestellt.

In den Tabellen 6-13 sind enantiomerenangereicherte Verbindungen durch ein ausgezeichnetes Wasserstoffatom am stereogenen Zentrum gekennzeichnet. Falls nicht ausdrücklich anders vermerkt, sind die gezeigten enantiomerenangereicherten Beispiele am 3-Amino-pyrrolidin-Stereozentrum (R)-konfiguriert.

#### b) Salzformen

Viele der erfindungsgemäßen Verbindungen sind Basen und können mit entsprechend starken Säuren Salze bilden. Insbesondere können die Verbindungen nach HPLC-chromatographischer Reinigung unter Verwendung eines Trifluoressigsäure enthaltenden Laufmittels als Hydrotrifluoracetate vorliegen. Diese können durch einfaches Behandeln einer Lösung der Salze z. B. mit Natriumcarbonatlösung in die gezeigten freien Basen überführt werden.

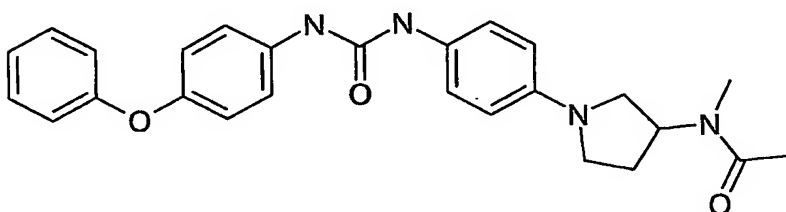
#### c) Einheiten der Charakterisierungsdaten

Die Einheit der angegebenen Molekulargewichte ist „g/mol“. Beobachtete Peaks im Massenspektrum sind angegeben als ganzzahliger Quotient der molaren Molekülionmasse und der Ladung des Molekülions (m/z).

#### Beispiel 1

APD62429PC

N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid

**Methode A**

Zu einer auf 0 °C gekühlten Lösung von Carbonyldiimidazol (2,92 g) in DMF (12 mL) wurde eine Lösung von 4-Phenoxy-anilin (3,33 g) in DMF (10 mL) getropft. Nach 30 Minuten wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid (3,80 g) in DMF (10 mL) zugetropft. Die Reaktionslösung wurde zunächst für 2 Stunden bei Raumtemperatur und dann für 30 Minuten bei 80°C gehalten. Die Mischung wurde in Wasser (600 mL) eingetropft und der entstandene Niederschlag abgesaugt und mit Wasser gewaschen. Alternativ kann das Produkt auch mit Ethylacetat extrahiert und nach dem Einengen durch Chromatographie gereinigt werden. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 444,54 (C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 445 (M+H<sup>+</sup>).

N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid

**Methode B**

Eine Suspension von N-Methyl-N-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid (3,5 g) und Palladium(II)hydroxid (20%ig auf Kohle; 0,9 g) in Ethanol (150 mL) und Ethylacetat (300 mL) wurde unter Wasserstoffatmosphäre (Normaldruck) für 3 Stunden heftig gerührt. Dann wurde der Katalysator durch Filtration entfernt und das Filtrat eingeeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 233,32 (C<sub>13</sub>H<sub>19</sub>N<sub>3</sub>O); MS (ESI): 234 (M+H<sup>+</sup>).

N-Methyl-N-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid

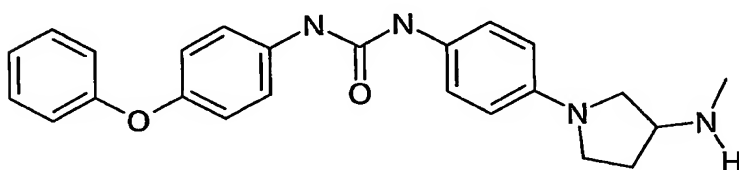
**Methode C**

APD62429PC

Eine Suspension von N-Methyl-N-pyrrolidin-3-yl-acetamid (25,2 g) und Caesiumcarbonat (57,6 g) in DMF (300 mL) wurde langsam mit 4-Fluor-nitrobenzol (25,0 g) versetzt. Nach 2 Stunden wurde die Reaktionsmischung auf Wasser gegossen und der entstandene Niederschlag abgesaugt. Alternativ kann das Produkt auch mit Ethylacetat extrahiert und nach dem Einengen durch Chromatographie gereinigt werden. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 263,30 ( $C_{13}H_{17}N_3O_3$ ); MS (ESI): 264 ( $M+H^+$ ).

### Beispiel 2

1-[4-(3-Methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-3-(4-phenoxy-phenyl)-harnstoff



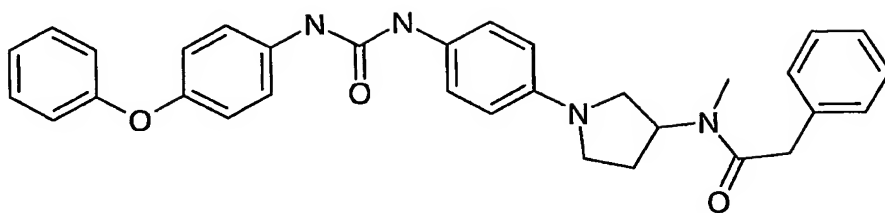
### Methode D

Eine Mischung aus N-Methyl-N-(1-[4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl]-pyrrolidin-3-yl)-acetamid (6,0 g), Ethanol (250 mL), Wasser (60 mL) und Natronlauge (10 M; 80 mL) wurde für 12 Stunden zum Rückfluss erhitzt. Der Alkohol wurde abdestilliert und der entstandene Niederschlag abgesaugt und mit Dichlormethan gewaschen. Zusätzliches Produkt wurde durch Einengen der organischen Phase und Chromatographie (Kieselgel, Dichlormethan/Methanol 9:1 mit 1% Triethylamin) gewonnen. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 402,50 ( $C_{24}H_{26}N_4O_2$ ); MS (ESI): 403 ( $M+H^+$ ).

### Beispiel 3

N-Methyl-N-(1-[4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl]-pyrrolidin-3-yl)-2-phenyl-acetamid

APD62429PC

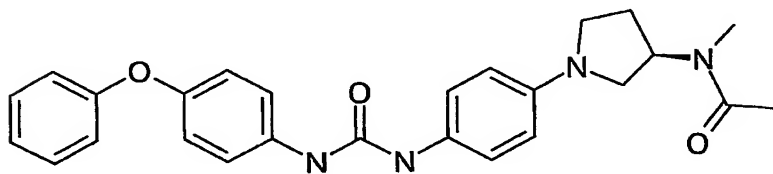


## Methode E

Eine Lösung von 1-[4-(3-Methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-3-(4-phenoxy-phenyl)-harnstoff (402 mg) in DMF (3 mL) wurde bei 0°C mit TOTU (327 mg) versetzt. Nach 10 Minuten wurde Hünig-Base (130 mg) und dann eine Lösung von Phenyllessigsäure (136 mg) in DMF (1 mL) zugesetzt. Nach 12 Stunden Reaktionszeit bei Raumtemperatur wurde die Mischung mit Wasser versetzt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 520,64 (C<sub>32</sub>H<sub>32</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 521 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

## Beispiel 4

(*R*)-N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid



Nach Methode A wurde (*R*)-N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 4-Phenoxy-anilin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 444,54 (C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 445 (M+H<sup>+</sup>).

(*R*)-N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid

APD62429PC

Nach Methode B wurde (*R*)-N-Methyl-N-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 233,32 (C<sub>13</sub>H<sub>19</sub>N<sub>3</sub>O); MS (ESI): 234 (M+H<sup>+</sup>).

(*R*)-N-Methyl-N-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid

#### Methode F

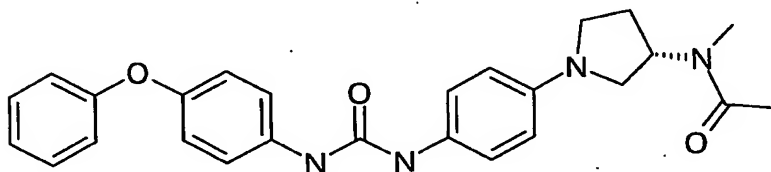
Eine Suspension von Natriumhydrid (50%ig in Öl; 0,25 g) in DMF (50 mL) wurde portionsweise mit (*R*)-N-[1-(4-Nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid (1,3 g) versetzt. Nach beendeter Gasentwicklung wurde Iodmethan (0,82 g) zugesetzt. Nach einer Stunde wurde die Reaktionsmischung vorsichtig mit Wasser hydrolysiert und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 263,30 (C<sub>13</sub>H<sub>17</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 264 (M+H<sup>+</sup>).

(*R*)-N-[1-(4-Nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid

Nach Methode C wurde (*R*)-N-Pyrrolidin-3-yl-acetamid mit 4-Fluor-nitrobenzol umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 249,27 (C<sub>12</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 250 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 5

(*S*)-N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid

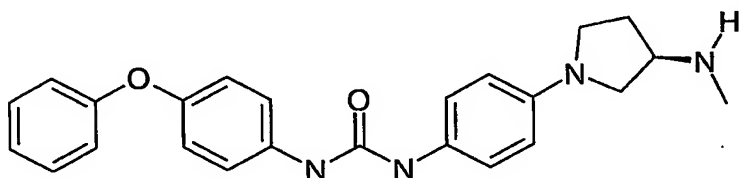


APD62429PC

Die im Beispiel 4 beschriebene Sequenz wurde auf (S)-N-Pyrrolidin-3-yl-acetamid angewendet. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 444,54 (C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 445 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 6

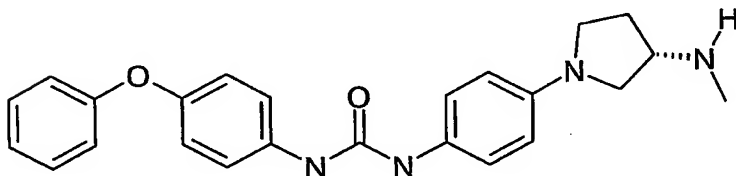
(R)-1-[4-(3-Methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-3-(4-phenoxy-phenyl)-harnstoff



Nach Methode D wurde (R)-N-Methyl-N-(1-[4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl]-pyrrolidin-3-yl)-acetamid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 402,50 (C<sub>24</sub>H<sub>26</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 403 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 7

(S)-1-[4-(3-Methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-3-(4-phenoxy-phenyl)-harnstoff

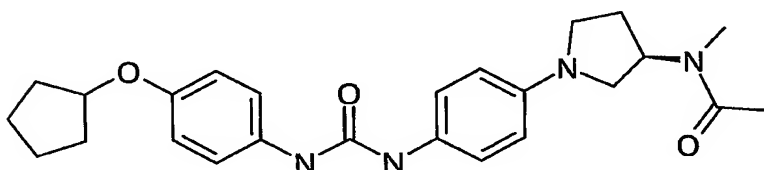


Nach Methode D wurde (S)-N-Methyl-N-(1-[4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl]-pyrrolidin-3-yl)-acetamid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 402,50 (C<sub>24</sub>H<sub>26</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 403 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 8

APD62429PC

(*R*)-N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid



Nach Methode A wurde (*R*)-N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 4-Cyclopentyloxy-anilin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 436,56 (C<sub>25</sub>H<sub>32</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 437 (M+H<sup>+</sup>).

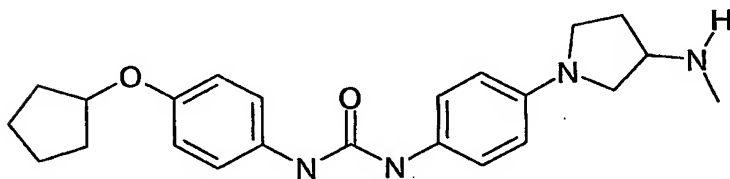
Analog wurde (*S*)-N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid aus (*S*)-N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid erhalten.

#### 4-Cyclopentyloxy-anilin

Eine Mischung von 4-Nitrophenol (63,7 g), Bromcyclopentan (68,2 g), Kaliumcarbonat (63,3 g) und DMF (300 mL) wurde für 24 Stunden auf 80 °C erwärmt. Nach dem Abkühlen wurde mit Wasser verdünnt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde nach Methode B hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 177,25 (C<sub>11</sub>H<sub>15</sub>NO); MS (ESI): 178 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 9

1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff



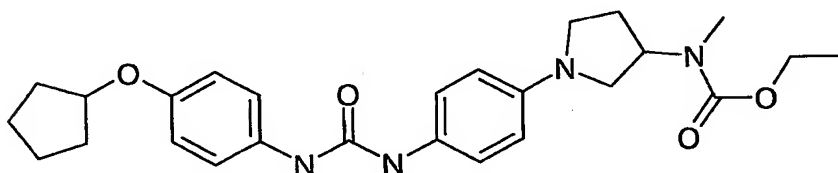
APD62429PC

Nach Methode D wurde N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 394,52 (C<sub>23</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 395 (M+H<sup>+</sup>).

Analog wurden (*R*)- und (*S*)-1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff aus (*R*)- und (*S*)-N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid erhalten.

#### Beispiel 10

(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäureethylester



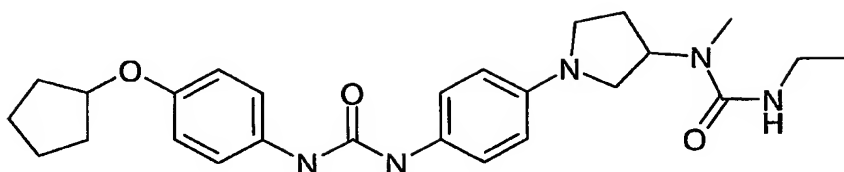
Zu einer Lösung von 1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff (20 mg) und Hünig-Base (10 mg) in Dichlormethan (3 mL) wurde Chlorameisensäureethylester (8 µL) getropft. Nach 12 Stunden wurde die Reaktionsmischung eingeeengt und der Rückstand durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 466,59 (C<sub>26</sub>H<sub>34</sub>N<sub>4</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 467 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

#### Beispiel 11

1-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-3-ethyl-1-methyl-harnstoff



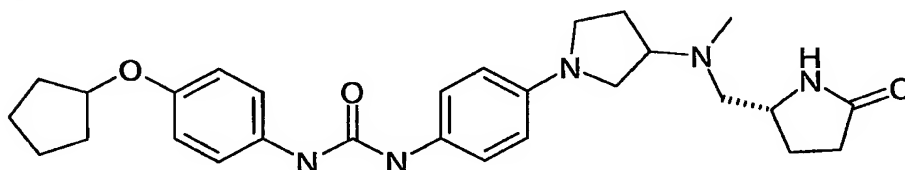
APD62429PC



Zu einer Lösung von 1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff (20 mg) und Hünig-Base (10 mg) in Dichlormethan (3 mL) wurde Ethylisocyanat (7  $\mu$ L) getropft. Nach 12 Stunden wurde die Reaktionsmischung eingeeengt und der Rückstand durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 465,60 (C<sub>26</sub>H<sub>35</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 466 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

#### Beispiel 12

1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-(4-{3-[methyl-((R)-5-oxo-pyrrolidin-2-ylmethyl)-amino]-pyrrolidin-1-yl}-phenyl)-harnstoff

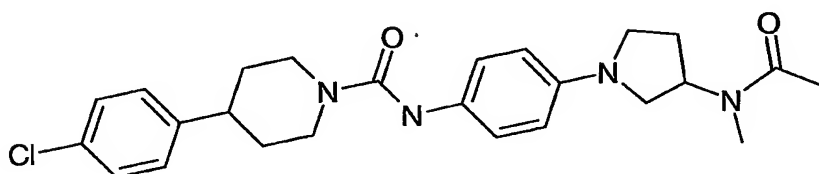


Zu einer Suspension von 1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff (30 mg) und Kaliumcarbonat (20 mg) in DMF (3 mL) wurde (*R*)-5-Brommethyl-pyrrolidin-2-on (15 mg) gegeben. Nach 2 Stunden wurde die Reaktionsmischung filtriert, eingeeengt und der Rückstand durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 491,64 (C<sub>28</sub>H<sub>37</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 492 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

#### Beispiel 13

APD62429PC

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid

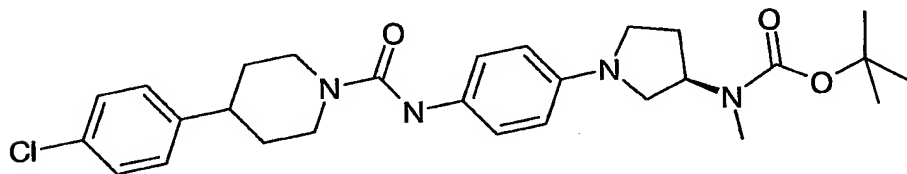


Nach Methode A wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit Carbonyldiimidazol und dann mit 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 455,00 (C<sub>25</sub>H<sub>31</sub>ClN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 455 (M+H<sup>+</sup>).

Analog wurden (*R*)- und (*S*)-4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid aus (*R*)- und (*S*)-N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid erhalten.

#### Beispiel 14

(*R*)-[1-(4-{[4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-amino}-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester



Nach Methode A wurde (*R*)-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester mit Carbonyldiimidazol und dann mit 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 513,09 (C<sub>28</sub>H<sub>37</sub>ClN<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 513 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

*(R)*-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode B wurde *(R)*-Methyl-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 291,40 (C<sub>16</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 292 (M+H<sup>+</sup>).

*(R)*-Methyl-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester

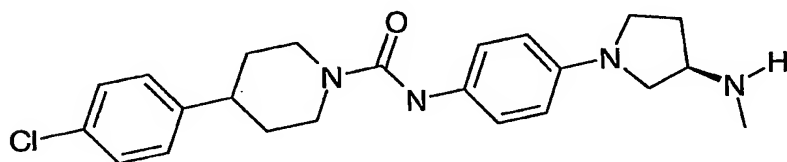
Nach Methode F wurde *(R)*-[1-(4-Nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester mit Iodmethan alkyliert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 321,38 (C<sub>16</sub>H<sub>23</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 322 (M+H<sup>+</sup>).

*(R)*-[1-(4-Nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C wurde *(R)*-Pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester mit 4-Fluor-nitrobenzol umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 307,35 (C<sub>15</sub>H<sub>21</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 308 (M+H<sup>+</sup>).

Beispiel 15

*(R)*-4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure [4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



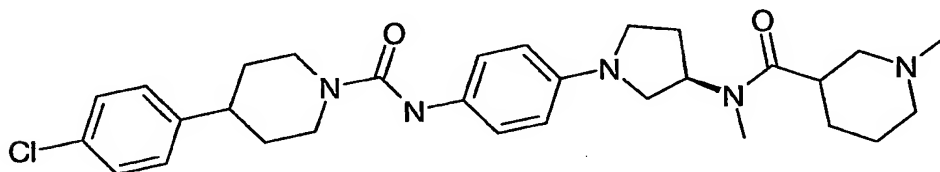
Methode G

APD62429PC

Eine Lösung von (*R*)-[1-(4-{[4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-amino}-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester (1,5 g) in Dichlormethan (50 mL) wurde mit Trifluoressigsäure (6,67 g) versetzt. Nach 3 Stunden wurden flüchtige Anteile entfernt und der Rückstand in Dichlormethan aufgenommen. Nach dem Waschen mit Natriumcarbonatlösung wurde die organische Phase über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 412,97 ( $C_{23}H_{29}ClN_4O$ ); MS (ESI): 413 ( $M+H^+$ ).

#### Beispiel 16

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure 4-[(*R*)-3-[methyl-(1-methyl-piperidin-3-yl-carbonyl)-amino]-pyrrolidin-1-yl]-phenyl)-amid

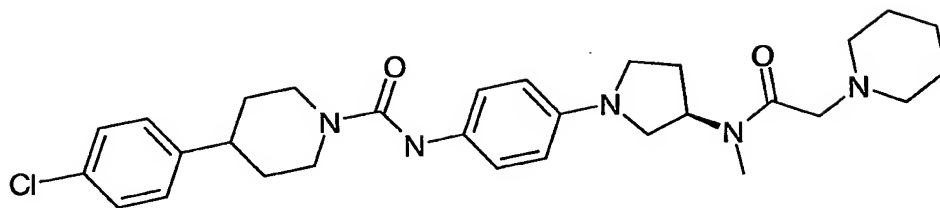


Nach Methode E wurde (*R*)-4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure [4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid mit 1-Methyl-piperidin-3-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 538,14 ( $C_{30}H_{40}ClN_5O_2$ ); MS (ESI): 538 ( $M+H^+$ ).

#### Beispiel 17

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure 4-(*R*)-{3-[methyl-(2-piperidin-1-yl-acetyl)-amino]-pyrrolidin-1-yl}-phenyl)-amid

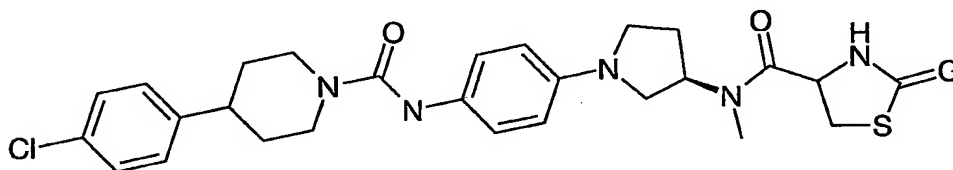
APD62429PC



Nach Methode E wurde (*R*)-4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure [4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid mit Piperidin-1-yl-essigsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 538,14 (C<sub>30</sub>H<sub>40</sub>ClN<sub>5</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 538 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 18

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure (4-(*R*)-{3-[methyl-(2-oxo-thiazolidin-4-carbonyl)-amino]-pyrrolidin-1-yl}-phenyl)-amid

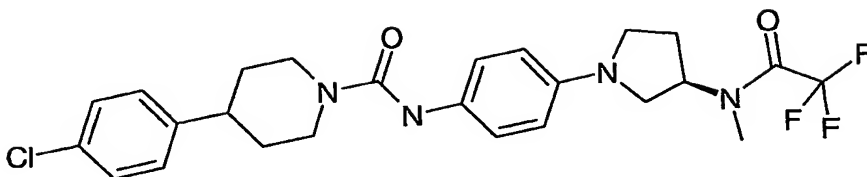


Nach Methode E wurde (*R*)-4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure [4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid mit 2-Oxo-thiazolidin-4-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 542,10 (C<sub>27</sub>H<sub>32</sub>ClN<sub>5</sub>O<sub>3</sub>S); MS (ESI): 542 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 19

(*R*)-4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure (4-{3-[methyl-(2,2,2-trifluor-acetyl)-amino]-pyrrolidin-1-yl}-phenyl)-amid

APD62429PC



Nach Methode A wurde (*R*)-[N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-2,2,2-trifluor-N-methyl-acetamid mit Carbonyldiimidazol und dann mit 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 508,98 (C<sub>25</sub>H<sub>28</sub>ClF<sub>3</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 509 (M+H<sup>+</sup>).

(*R*)-[N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-2,2,2-trifluor-N-methyl-acetamid

Nach Methode B wurde (*R*)-2,2,2-Trifluor-N-methyl-N-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 287,29 (C<sub>13</sub>H<sub>16</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O); MS (ESI): 288 (M+H<sup>+</sup>).

(*R*)-2,2,2-Trifluor-N-methyl-N-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid

Zu einer Lösung von (*R*)-Methyl-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-amin (0,48 g) in Pyridin (2 mL) wurde Trifluoressigsäureanhydrid (0,5 mL) getropft. Nach 3 Stunden wurde die Reaktionsmischung mit Wasser verdünnt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde mit Zitronensäurelösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 317,27 (C<sub>13</sub>H<sub>14</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 318 (M+H<sup>+</sup>).

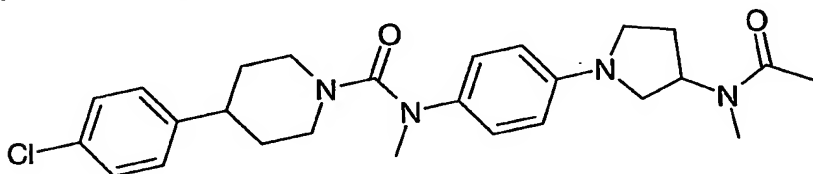
(*R*)-Methyl-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-amin

APD62429PC

Eine Lösung von (*R*)-Methyl-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester (0,7 g) in Dichlormethan (5 mL) wurde für 1 Stunde mit Trifluoressigsäure (3 mL) behandelt. Die Reaktionslösung wurde eingeeengt und der Rückstand in Dichlormethan aufgenommen. Nach dem Waschen mit Natriumcarbonatlösung wurde die organische Phase über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 221,26 (C<sub>11</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 222 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 20

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-methyl-amid

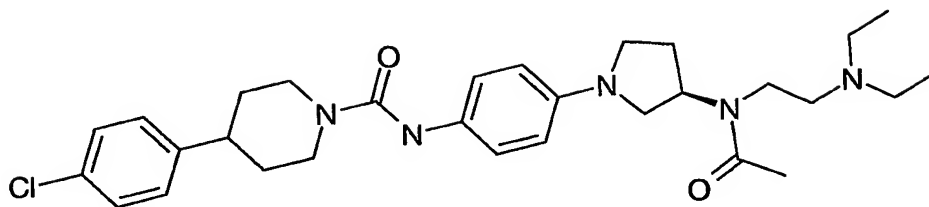


Nach Methode F wurde 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid mit Iodmethan umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 469,03 (C<sub>26</sub>H<sub>33</sub>ClN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 469 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 21

(*R*)-4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure (4-{3-[acetyl-(2-diethylamino-ethyl)-amino]-pyrrolidin-1-yl}-phenyl)-amid

APD62429PC



Nach Methode A wurde (*R*)-N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-(2-diethylamino-ethyl)-acetamid mit 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 540,15 (C<sub>30</sub>H<sub>42</sub>ClN<sub>5</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 540 (M+H<sup>+</sup>).

(*R*)-N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-(2-diethylamino-ethyl)-acetamid

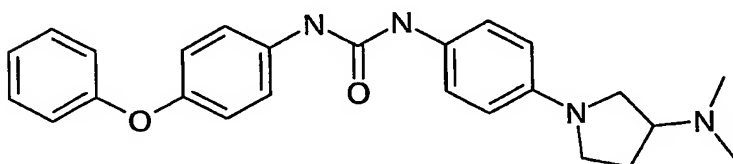
Nach Methode B wurde (*R*)-N-(2-Diethylamino-ethyl)-N-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 318,47 (C<sub>18</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O); MS (ESI): 319 (M+H<sup>+</sup>).

(*R*)-N-(2-Diethylamino-ethyl)-N-[1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid

Nach Methode F wurde (*R*)-N-[1-(4-Nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid mit 2-Chlorethyl-diethylamin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 348,45 (C<sub>18</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 349 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 22

1-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-3-(4-phenoxy-phenyl)-harnstoff



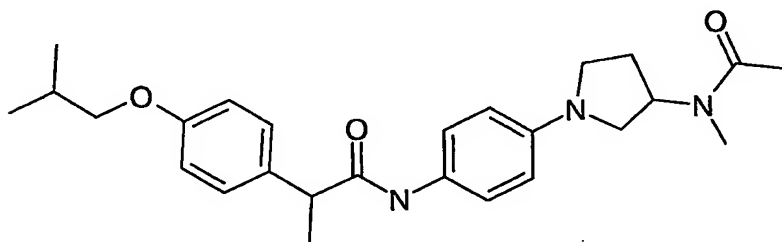


APD62429PC

Nach Methode A, B und C wurde Dimethyl-pyrrolidin-3-yl-amin mit 4-Fluor-nitrobenzol umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend das Anilin mit CDI und 4-Phenoxyanilin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 416,53 (C<sub>25</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 417 (M+H<sup>+</sup>).

### Beispiel 23

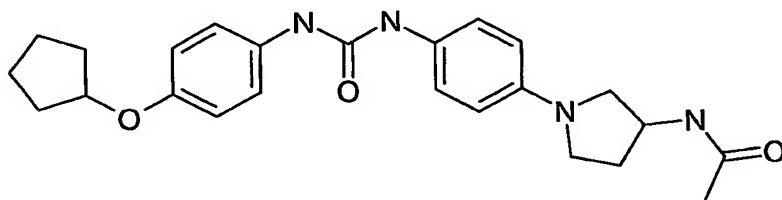
N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-isobutoxy-phenyl)-propionamid



Nach Methode E wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 2-(4-Isobutoxy-phenyl)-propionsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 437,59 (C<sub>26</sub>H<sub>35</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 438 (M+H<sup>+</sup>).

### Beispiel 24

N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid



Nach Methode A, B und C wurde N-Pyrrolidin-3-yl-acetamid mit 4-Fluor-nitrobenzol umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend

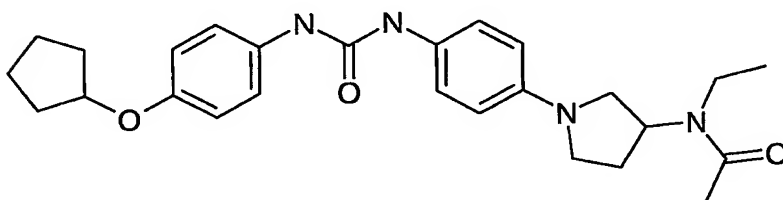
APD62429PC

das Anilin mit CDI und 4-Cyclopentyloxy-anilin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 422,53 ( $C_{24}H_{30}N_4O_3$ ); MS (ESI): 423 ( $M+H^+$ ).

In analoger Weise wurden ausgehend von (*R*)- und (*S*)-N-Pyrrolidin-3-yl-acetamid (*R*)- und (*S*)-N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid erhalten.

## Beispiel 25

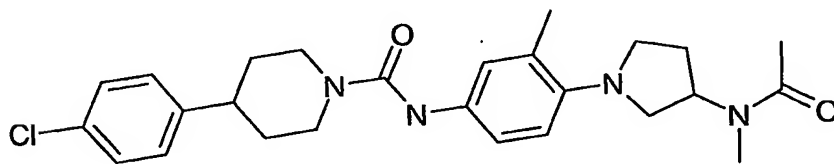
N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-ethyl-acetamid



Nach Methode A, B und C wurde N-Ethyl-N-pyrrolidin-3-yl-acetamid mit 4-Fluor-nitrobenzol umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend das Anilin mit CDI und 4-Cyclopentyloxy-anilin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 450,59 ( $C_{26}H_{34}N_4O_3$ ); MS (ESI): 451 ( $M+H^+$ ).

## Beispiel 26

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-3-methyl-phenyl}-amid

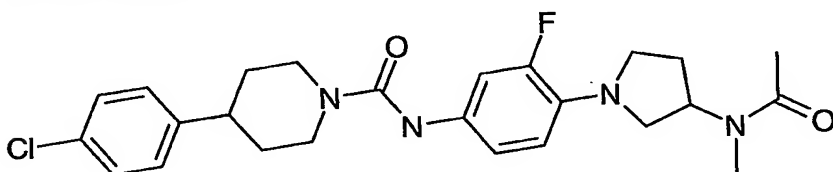


APD62429PC

Nach Methode A, B und C wurde N-Methyl-N-pyrrolidin-3-yl-acetamid mit 1-Fluor-2-methyl-4-nitro-benzol umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend das Anilin mit CDI und 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 469,03 ( $C_{26}H_{33}ClN_4O_2$ ); MS (ESI): 469 ( $M+H^+$ ).

#### Beispiel 27

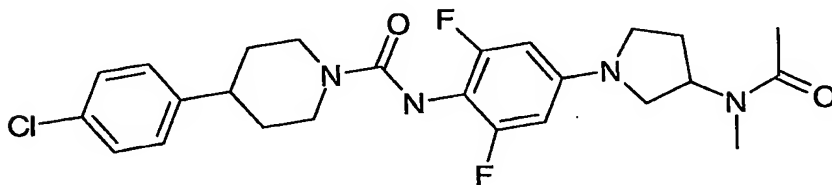
4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-3-fluor-phenyl}-amid



Nach Methode A, B und C wurde N-Methyl-N-pyrrolidin-3-yl-acetamid mit 1,2-Difluor-4-nitro-benzol umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend das Anilin mit CDI und 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 472,99 ( $C_{25}H_{30}ClF_2N_4O_2$ ); MS (ESI): 473 ( $M+H^+$ ).

#### Beispiel 28

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-2,6-difluor-phenyl}-amid

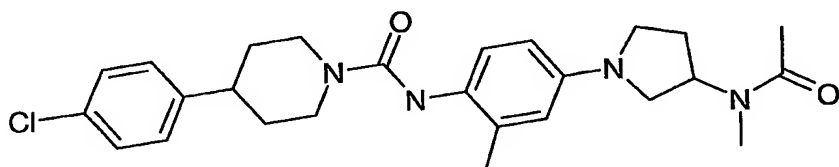


APD62429PC

Nach Methode A, B und C wurde N-Methyl-N-pyrrolidin-3-yl-acetamid mit 1,3,5-Trifluor-2-nitro-benzol umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend das Anilin mit CDI und 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 490,99 ( $C_{25}H_{29}ClF_2N_4O_2$ ); MS (ESI): 491 ( $M+H^+$ ).

#### Beispiel 29

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-2-methyl-phenyl}-amid

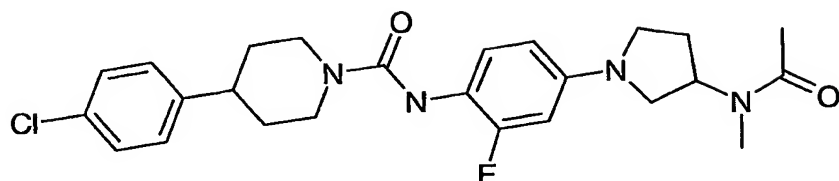


Nach Methode A, B und C wurde N-Methyl-N-pyrrolidin-3-yl-acetamid mit 4-Fluor-2-methyl-1-nitro-benzol umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend das Anilin mit CDI und 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 469,03 ( $C_{26}H_{33}ClN_4O_2$ ); MS (ESI): 469 ( $M+H^+$ ).

#### Beispiel 30

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-2-fluor-phenyl}-amid

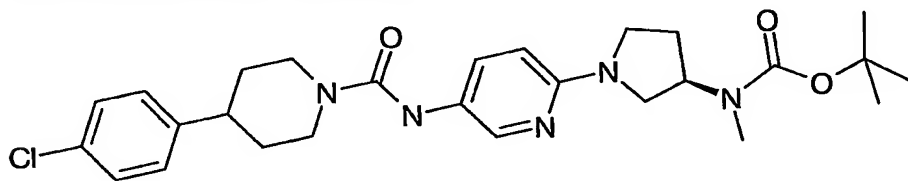
APD62429PC



Nach Methode A, B und C wurde N-Methyl-N-pyrrolidin-3-yl-acetamid mit 2,4-Difluor-1-nitro-benzol umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend das Anilin mit CDI und 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 472,99 (C<sub>25</sub>H<sub>30</sub>ClFN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 473 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 31

(R)-[1-(5-[[4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-amino]-pyridin-2-yl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

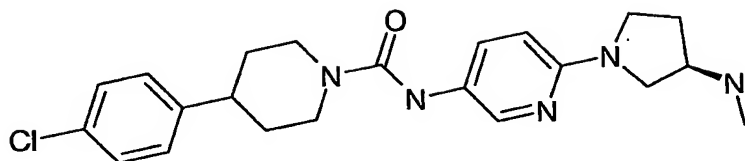


Die Synthesesequenz zur Darstellung von (R)-[1-(4-[[4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-amino]-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester ausgehend von 2-Chlor-5-nitropyridin statt 4-Fluor-nitrobenzol wurde durchlaufen. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 514,07 (C<sub>27</sub>H<sub>36</sub>ClN<sub>5</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 514 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 32

(R)-[4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure [6-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-amid

APD62429PC

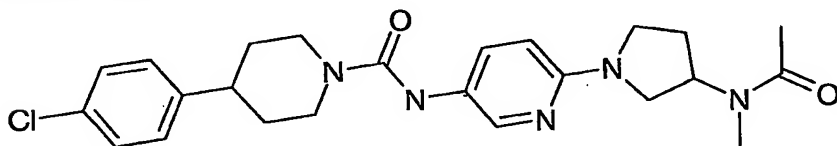


Nach Methode G wurde (*R*)-[1-(5-[[4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-amino]-pyridin-2-yl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester mit Trifluoressigsäure behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 413,95 ( $C_{22}H_{28}ClN_5O$ ); MS (ESI): 414 ( $M+H^+$ ).

In analoger Weise konnte man racemisches [4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure [6-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-amid erhalten.

#### Beispiel 33

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {6-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-pyridin-3-yl}-amid

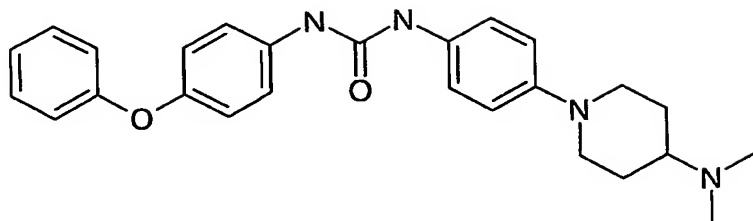


Nach Methode A, B und C wurde N-Methyl-N-pyrrolidin-3-yl-acetamid mit 2-Chlor-5-nitropyridin umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend das Anilin mit CDI und 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 490,99 ( $C_{25}H_{29}ClF_2N_4O_2$ ); MS (ESI): 491 ( $M+H^+$ ).

#### Beispiel 34

1-[4-(4-Dimethylamino-piperidin-1-yl)-phenyl]-3-(4-phenoxy-phenyl)-harnstoff

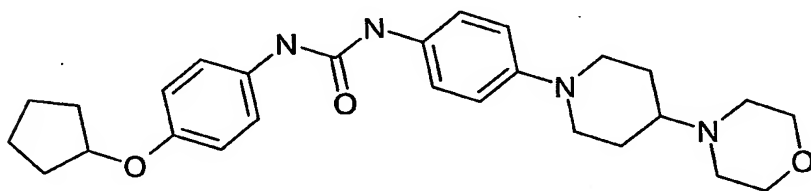
APD62429PC



Nach Methode A, B und C wurde Dimethyl-piperidin-4-yl-amin mit 4-Fluor-nitrobenzol umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend das Anilin ([1-(4-Amino-phenyl)-piperidin-4-yl]-dimethyl-amin) mit CDI und 4-Phenoxy-anilin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 430,55 (C<sub>26</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 431 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 35

1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(4-morpholin-4-yl-piperidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff

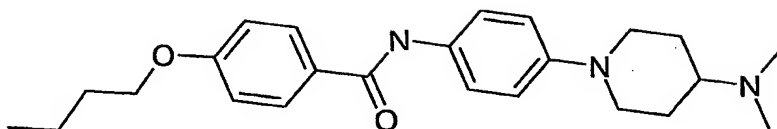


Nach Methode A, B und C wurde 4-Piperidin-4-yl-morpholin mit 4-Fluor-nitrobenzol umgesetzt, die erhaltene Nitroverbindung mit Wasserstoff reduziert und abschließend das Anilin mit CDI und 4-Cyclopentyloxy-anilin zur Reaktion gebracht. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 464,61 (C<sub>27</sub>H<sub>36</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 465 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 36

4-Butoxy-N-[4-(4-dimethylamino-piperidin-1-yl)-phenyl]-benzamid

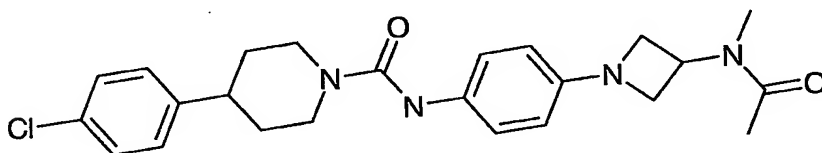
APD62429PC



Nach Methode E wurde ([1-(4-Amino-phenyl)-piperidin-4-yl]-dimethyl-amin) mit 4-4-Butoxy-benzoesäure umgesetzt . Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 395,55 (C<sub>24</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 396 (M+H<sup>+</sup>).

### Beispiel 37

4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-azetidin-1-yl]-phenyl}-amid



Nach Methode A wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-azetidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit Carbonyldiimidazol und 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 440,98 (C<sub>24</sub>H<sub>29</sub>ClN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 441 (M+H<sup>+</sup>).

N-[1-(4-Amino-phenyl)-azetidin-3-yl]-N-methyl-acetamid

Nach Methode B wurde N-Methyl-N-[1-(4-nitro-phenyl)-azetidin-3-yl]-acetamid hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 219,29 (C<sub>12</sub>H<sub>17</sub>N<sub>3</sub>O); MS (ESI): 220 (M+H<sup>+</sup>).

N-Methyl-N-[1-(4-nitro-phenyl)-azetidin-3-yl]-acetamid

Nach Methode F wurde N-[1-(4-Nitro-phenyl)-azetidin-3-yl]-acetamid mit Iodmethan alkyliert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 249,27 (C<sub>12</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 250 (M+H<sup>+</sup>).



APD62429PC

**N-[1-(4-Nitro-phenyl)-azetidin-3-yl]-acetamid**

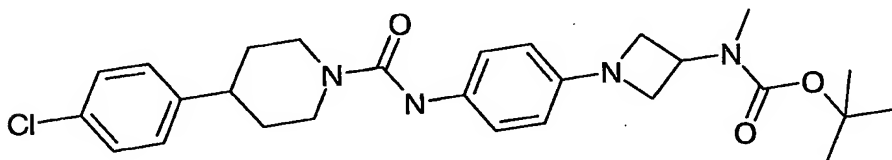
Eine Lösung von 1-(4-Nitro-phenyl)-azetidin-3-ylamin (0,5 g) in Pyridin (1,2 mL) wurde mit Essigsäureanhydrid (0,6 mL) versetzt. Nach einer Stunde wurden flüchtige Anteile entfernt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 235,24 (C<sub>11</sub>H<sub>13</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 236 (M+H<sup>+</sup>).

**1-(4-Nitro-phenyl)-azetidin-3-ylamin**

Nach Methode G wurde [1-(4-Nitro-phenyl)-azetidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester mit Trifluoressigsäure behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 193,21 (C<sub>9</sub>H<sub>11</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 194 (M+H<sup>+</sup>).

**[1-(4-Nitro-phenyl)-azetidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester**

Nach Methode C wurde Azetidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester mit 4-Fluor-nitrobenzol umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 293,33 (C<sub>14</sub>H<sub>19</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 294 (M+H<sup>+</sup>).

**Beispiel 38****[1-(4-[[4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-amino]-phenyl)-azetidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester**

Nach Methode A wurde [1-(4-Amino-phenyl)-azetidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester mit Carbonyldiimidazol und 4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 499,06 (C<sub>27</sub>H<sub>35</sub>ClN<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 499 (M+H<sup>+</sup>).

**[1-(4-Amino-phenyl)-azetidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester**

APD62429PC

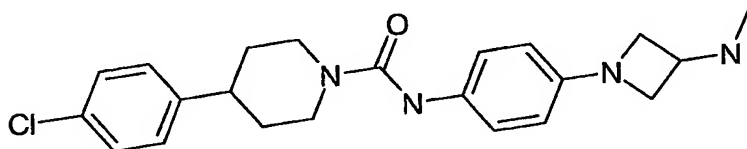
Nach Methode B wurde Methyl-[1-(4-nitro-phenyl)-azetidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 277,37 ( $C_{15}H_{23}N_3O_2$ ); MS (ESI): 278 ( $M+H^+$ ).

Methyl-[1-(4-nitro-phenyl)-azetidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode F wurde [1-(4-Nitro-phenyl)-azetidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester mit Iodmethan alkyliert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 307,35 ( $C_{15}H_{21}N_3O_4$ ); MS (ESI): 308 ( $M+H^+$ ).

#### Beispiel 39

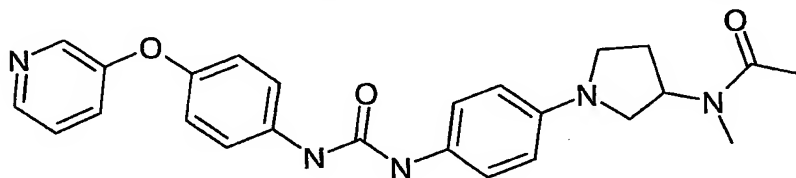
4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure [4-(3-methylamino-azetidin-1-yl)-phenyl]-amid



Nach Methode G wurde [1-(4-{[4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonyl]-amino}-phenyl)-azetidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester mit Trifluoressigsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 398,94 ( $C_{22}H_{27}ClN_4O$ ); MS (ESI): 399 ( $M+H^+$ ).

#### Beispiel 40

N-Methyl-N-[1-(4-{3-[4-(pyridin-3-yloxy)-phenyl]-ureido}-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid

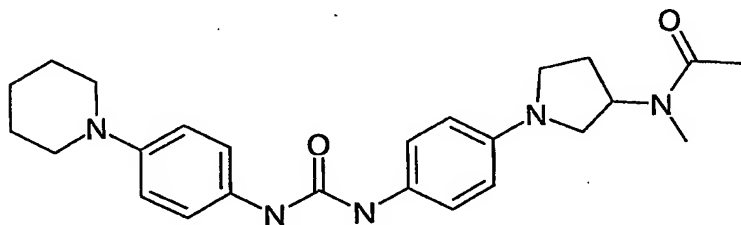


APD62429PC

Nach Methode A wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit Carbonyldiimidazol und dann mit 4-(Pyridin-3-yloxy)-phenylamin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 445,53 (C<sub>25</sub>H<sub>27</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 446 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 41

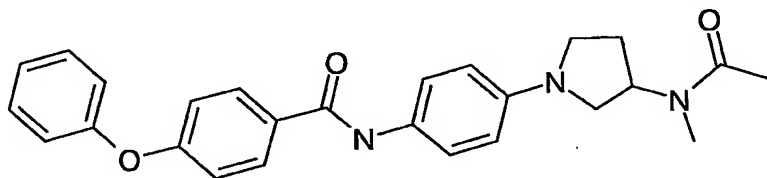
N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-piperidin-1-yl-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid



Nach Methode A wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit Carbonyldiimidazol und dann mit 4-Piperidin-1-yl-phenylamin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 435,57 (C<sub>25</sub>H<sub>33</sub>N<sub>5</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 436 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 42

N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-phenoxy-benzamid

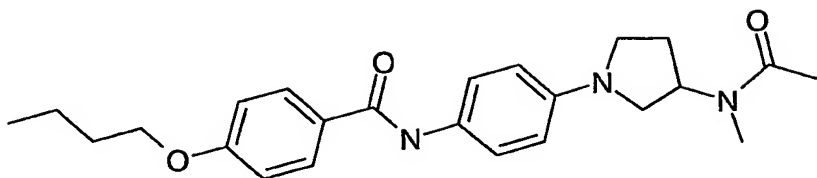


Nach Methode E wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 4-Phenoxybenzoesäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 429,52 (C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 430 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 43

N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-butoxy-benzamid

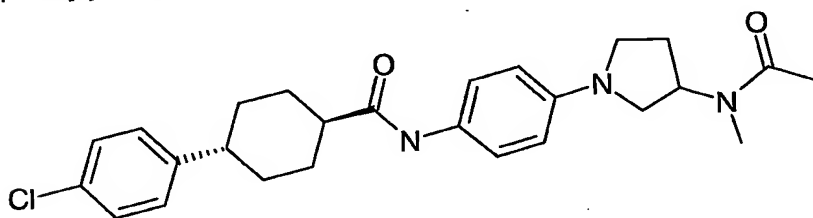
APD62429PC



Nach Methode E wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 4-Butoxybenzoesäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 409,53 (C<sub>24</sub>H<sub>31</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 410 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 44

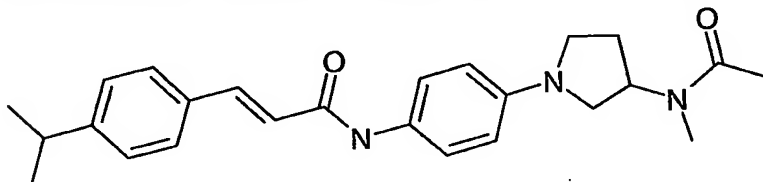
4-(4-Chlor-phenyl)-cyclohexancarbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid



Nach Methode E wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 4-(4-Chlor-phenyl)-cyclohexancarbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 454,02 (C<sub>26</sub>H<sub>32</sub>ClN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 454 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 45

N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-3-(4-isopropyl-phenyl)-acrylamid

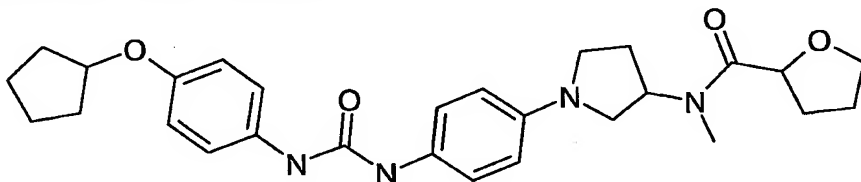


APD62429PC

Nach Methode E wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 3-(4-Isopropyl-phenyl)-acrylsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 405,54 (C<sub>25</sub>H<sub>31</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 406 (M+H<sup>+</sup>).

**Beispiel 46**

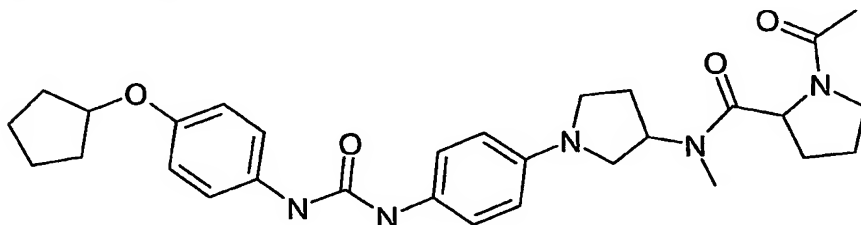
Tetrahydro-furan-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid



Nach Methode E wurde 1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff mit Tetrahydro-furan-2-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 492,62 (C<sub>28</sub>H<sub>36</sub>N<sub>4</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 493 (M+H<sup>+</sup>).

**Beispiel 47**

1-Acetyl-pyrrolidin-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid

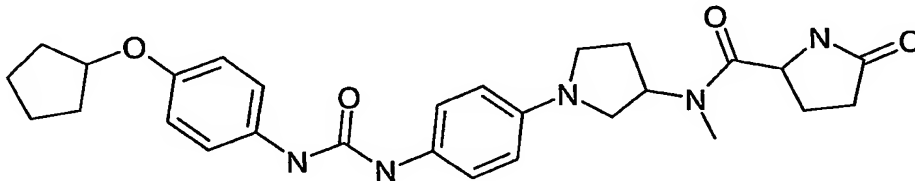


APD62429PC

Nach Methode E wurde 1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff mit 1-Acetyl-pyrrolidin-2-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 533,68 (C<sub>30</sub>H<sub>39</sub>N<sub>5</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 534 (M+H<sup>+</sup>).

**Beispiel 48**

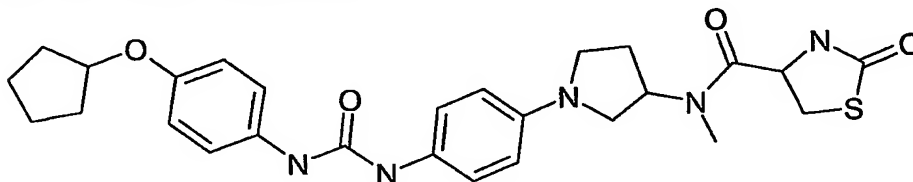
5-Oxo-pyrrolidin-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid



Nach Methode E wurde 1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff mit 5-Oxo-pyrrolidin-2-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 505,62 (C<sub>28</sub>H<sub>35</sub>N<sub>5</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 506 (M+H<sup>+</sup>).

**Beispiel 49**

2-Oxo-thiazolidin-4-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid

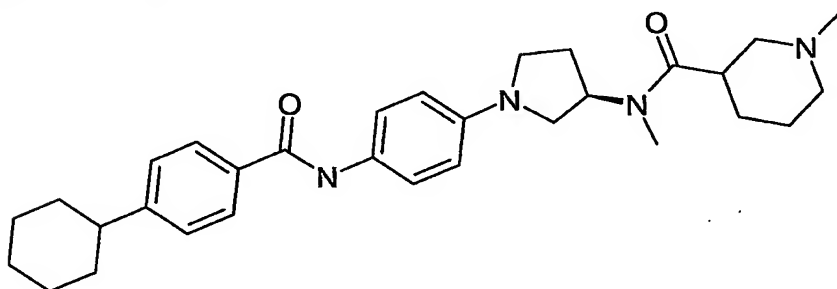


Nach Methode E wurde 1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff mit 2-Oxo-thiazolidin-4-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 523,66 (C<sub>27</sub>H<sub>33</sub>N<sub>5</sub>O<sub>4</sub>S); MS (ESI): 524 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

## Beispiel 50

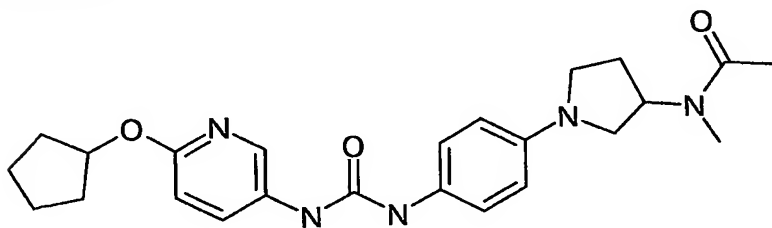
(R)-1-Methyl-piperidin-3-carbonsäure {1-[4-(4-cyclohexyl-benzoylamino)-phenyl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-amid



Nach Methode E wurde (R)-4-Cyclohexyl-N-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid mit 1-Methyl-piperidin-3-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 502,71 (C<sub>31</sub>H<sub>42</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 503 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 51

N-(1-[4-[3-(6-Cyclopentyloxy-pyridin-3-yl)-ureido]-phenyl]-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid



Nach Methode A wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit Carbonyldiimidazol und dann 6-Cyclopentyloxy-pyridin-3-ylamin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 437,55 (C<sub>24</sub>H<sub>31</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 438 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

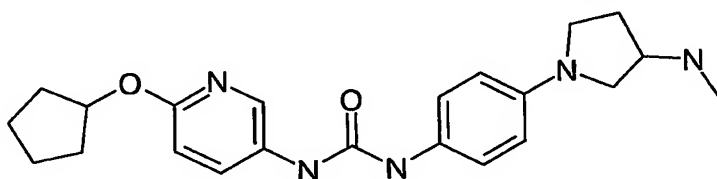
**6-Cyclopentyloxy-pyridin-3-ylamin**

Eine Mischung aus 5-Nitro-pyridin-2-ol (14,0 g), Bromcyclopentan (8,0 g), Kaliumcarbonat (14 g) und DMF (200 mL) wurde für 6 Stunden auf 80 °C erwärmt. Nach dem Abkühlen wurde die Reaktionsmischung mit Wasser verdünnt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch Chromatographie an Kieselgel gereinigt. Das erhaltene Produkt (2-Cyclopentyloxy-5-nitro-pyridin) wurde nach Methode B hydriert.

Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 178,24 (C<sub>10</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O); MS (ESI): 179 (M+H<sup>+</sup>).

**Beispiel 52**

**1-(6-Cyclopentyloxy-pyridin-3-yl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff**



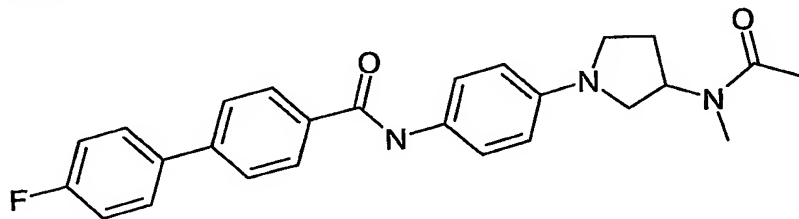
Nach Methode D wurde N-(1-{4-[3-(6-Cyclopentyloxy-pyridin-3-yl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid mit Natronlauge behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 395,51 (C<sub>22</sub>H<sub>29</sub>N<sub>5</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 395 (M+H<sup>+</sup>).

**Beispiel 53**



APD62429PC

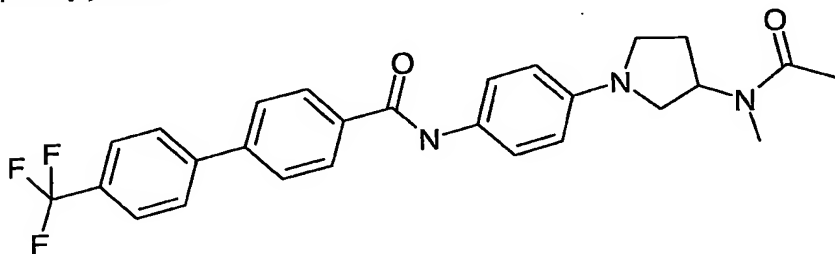
4'-Fluor-biphenyl-4-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid



Nach Methode E wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 4'-Fluor-biphenyl-4-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 431,51 (C<sub>26</sub>H<sub>26</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 432 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 54

4'-Trifluormethyl-biphenyl-4-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid



Nach Methode E wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 4'-Trifluormethyl-biphenyl-4-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 481,52 (C<sub>27</sub>H<sub>26</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 482 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiele 55 – 103

Nach Methode E wurde 1-(4-Phenoxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff mit verschiedenen Carbonsäuren umgesetzt. Die Produkte sind in der Tabelle 2 zusammengefasst.

APD62429PC

**Beispiele 104 – 144**

Nach Methode E wurde 1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff mit verschiedenen Carbonsäuren umgesetzt. Die Produkte sind in der Tabelle 3 zusammengefasst.

**Beispiele 145-185**

Nach Methode E wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit verschiedenen Carbonsäuren umgesetzt. Die Produkte sind in der Tabelle 4 zusammengefasst.

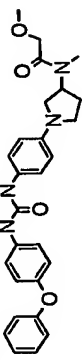
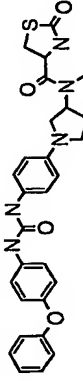
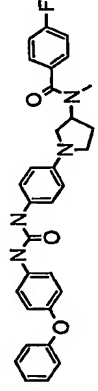
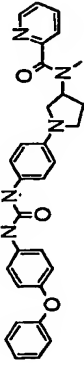
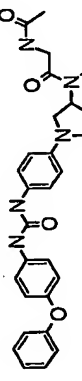
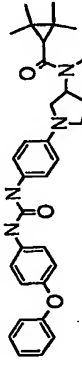
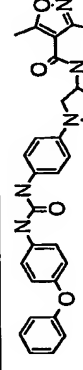
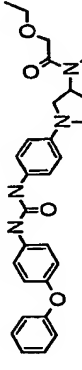
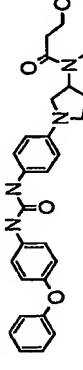
**Beispiele 186-234**

Nach Methode A wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit Carbonyldiimidazol und dann mit verschiedenen Aminen umgesetzt. Die Produkte sind in der Tabelle 5 zusammengefasst.

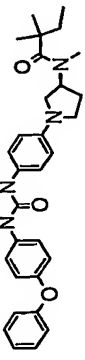
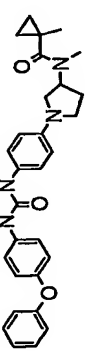
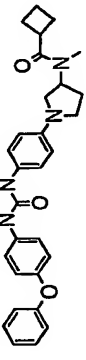
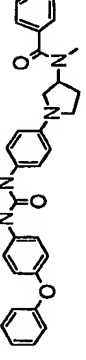
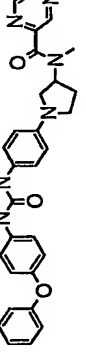
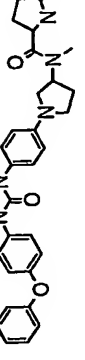
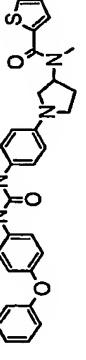
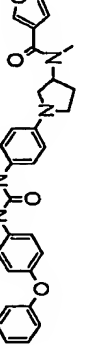
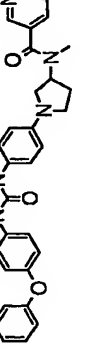
Tabelle 2

Bsp. No.	Struktur	Name	Summen-formel	Molekular-gewicht	M+H+
55		Cyclopropanecarbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C28H30N4O3	470,58	471
56		3,N-Dimethyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-butyramid	C29H34N4O3	486,62	487
57		2,N-Dimethyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-butyramid	C29H34N4O3	486,62	487
58		N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-benzamid	C31H30N4O3	506,61	507
59		(E)-N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-3-phenyl-acrylamid	C33H32N4O3	532,65	533
60		2-Cyclopentyl-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C31H36N4O3	512,66	513
61		Cyclohexancarbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C31H36N4O3	512,66	513
62		N-Methyl-2-methylsulfanyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C27H30N4O3S	490,63	491

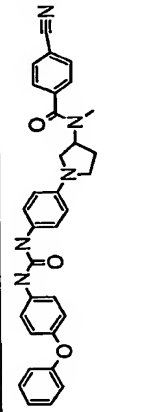
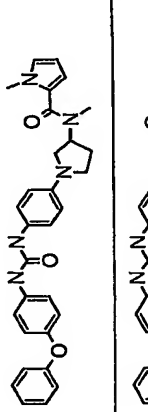
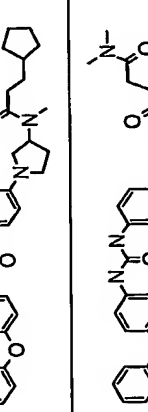
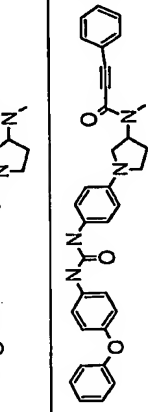
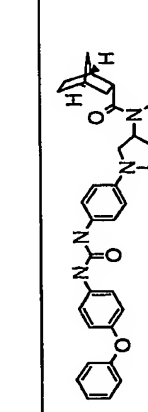
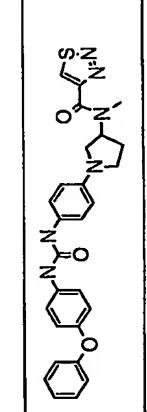
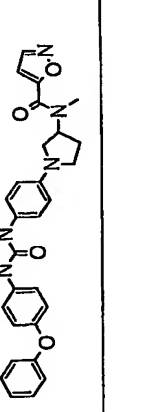

APD62429PC

63		2-Methoxy-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C27H30N4O4	474,56	475
64		2-Oxo-thiazolidin-4-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C28H29N5O4S	531,64	532
65		4-Fluor-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-benzamid	C31H29FN4O3	524,60	525
66		Pyridin-2-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C30H29N5O3	507,60	508
67		2-Acetylamino-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C28H31N5O4	501,59	502
68		2,2,3,3-Tetramethyl-cyclopropancarbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C32H38N4O3	526,68	527
69		3,5-Dimethyl-isoxazole-4-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C30H31N5O4	525,61	526
70		2-Ethoxy-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C28H32N4O4	488,59	489
71		3-Methoxy-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-propionamid	C28H32N4O4	488,59	489

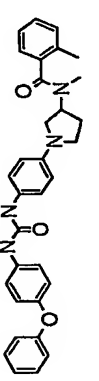
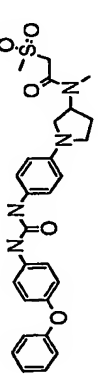
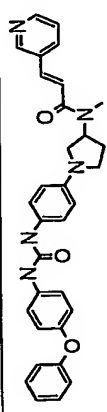
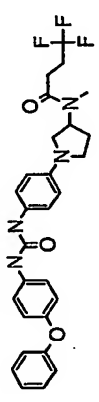
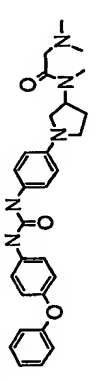
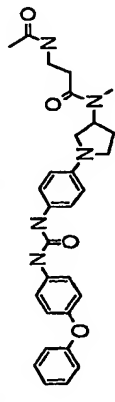
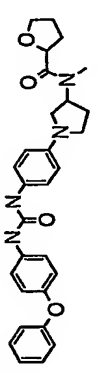
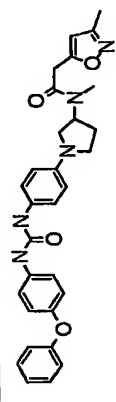
APD62429PC

72		2,2,N-Trimethyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-butyramid	C30H36N4O3	500,65	501
73		1-Methyl-cyclopropanecarbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C29H32N4O3	484,60	485
74		Cyclobutancarbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C29H32N4O3	484,60	485
75		N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-isonicotinamid	C30H29N5O3	507,60	508
76		Pyrazin-2-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C29H28N6O3	508,58	509
77		5-Oxo-pyrrolidin-2-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C29H31N5O4	513,60	514
78		Thiophene-2-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C29H28N4O3S	512,64	513
79		Furan-3-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C29H28N4O4	496,57	497
80		N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-nicotinamid	C30H29N5O3	507,60	508

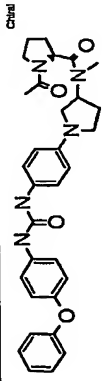
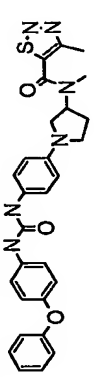
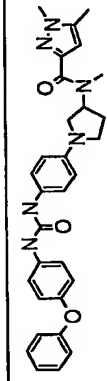
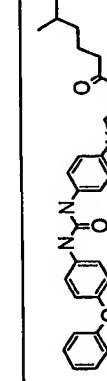
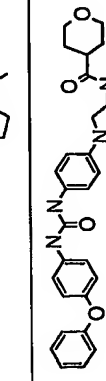
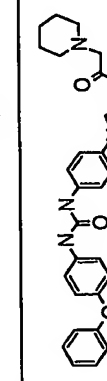
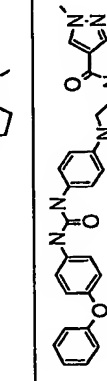
APD62429PC

81		4-Cyano-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-benzamid	C32H29N5O3	531,62	532
82		1-Methyl-1H-pyrrol-2-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C30H31N5O3	509,61	510
83		3-Cyclopentyl-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-propionamid	C32H38N4O3	526,68	527
84		N,N,N'-Trimethyl-N'-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-succinamid	C30H35N5O4	529,64	530
85		3-Phenyl-propionsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C33H30N4O3	530,63	531
86		(1R,4S)-Bicyclo[2.2.1]heptan-2-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C32H36N4O3	524,67	525
87		[1,2,3]Thiadiazole-4-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C27H26N6O3S	514,61	515
88		Isoxazole-5-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C28H27N5O4	497,56	498

APD62429PC

89		2, N-Dimethyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-benzamid	C32H32N4O3	520,64	521
90		2-Methanesulfonyl-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C27H30N4O5S	522,63	523
91		(E)-N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-3-pyridin-3-yl-acrylamid	C32H31N5O3	533,64	534
92		4,4,4-Trifluor-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-butyramid	C28H29F3N4O3	526,56	527
93		2-Dimethylamino-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C28H33N5O3	487,61	488
94		3-Acetylamino-N-methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-propionamid	C29H33N5O4	515,62	516
95		Tetrahydro-furan-2-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C29H32N4O4	500,60	501
96		N-Methyl-2-(3-methyl-isoxazol-5-yl)-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C30H31N5O4	525,61	526

APD62429PC

97		(S)-1-Acetyl-pyrrolidin-2-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C31H35N5O4	541,66	542
98		4-Methyl-[1,2,3]thiadiazole-5-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C28H28N6O3S	528,64	529
99		1,5-Dimethyl-1H-pyrazole-3-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C30H32N6O3	524,63	525
100		5-Methyl-hexanoic acid methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C31H38N4O3	514,67	515
101		Tetrahydro-pyran-4-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C30H34N4O4	514,63	515
102		N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-2-piperidin-1-yl-acetamid	C31H37N5O3	527,67	528
103		1,3-Dimethyl-1H-pyrazole-4-carbonsäure-methyl-(1-{4-[3-(4-phenoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-amid	C30H32N6O3	524,63	525

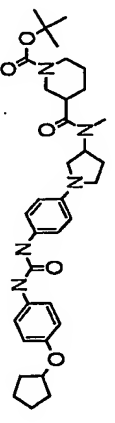
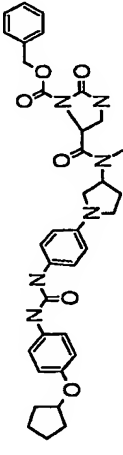
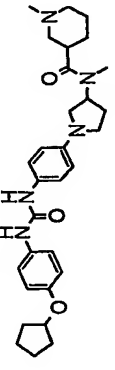
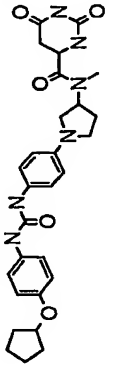
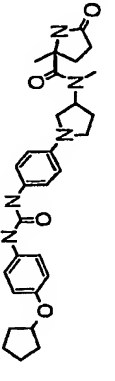
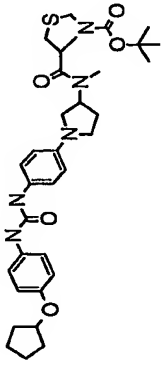


APD62429PC

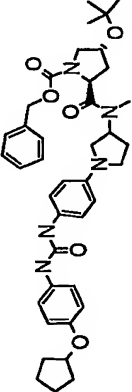
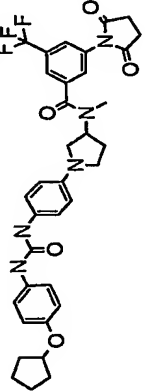
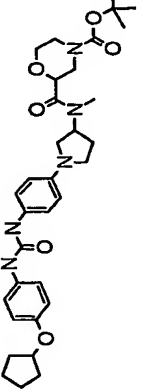
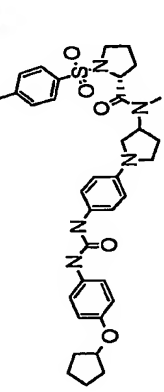
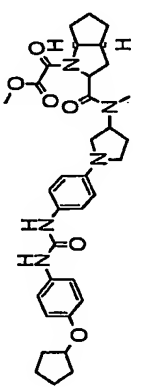
Tabelle 3

Bsp. No.	Struktur	Name	Summenformel	Molekulargewicht	M+H+
104	<p>Chiral</p>	(S)-5-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-2-oxo-imidazolidin-1-carbonsäure benzyl ester	C35H40N6O6	640,75	641
105	<p>Chiral</p>	(R)-2-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-pyrrolidin-1-carbonsäure benzyl ester	C36H43N5O5	625,77	626
106		N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-3-dimethylamino-N-methyl-benzamid	C32H39N5O3	541,70	542
107	<p>Chiral</p>	(S)-2-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-5-oxo-pyrrolidin-1-carbonsäure benzyl ester	C36H41N5O6	639,76	640

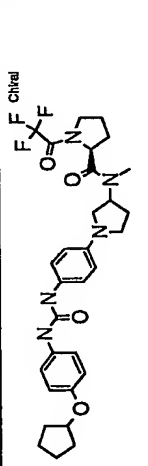
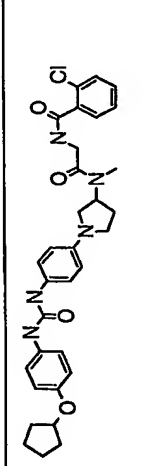
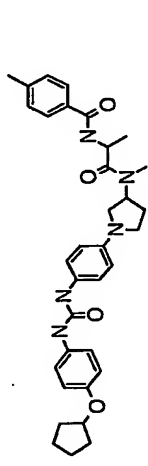
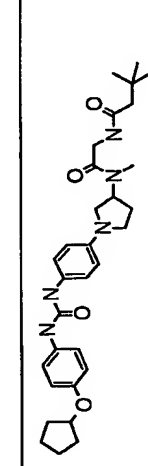
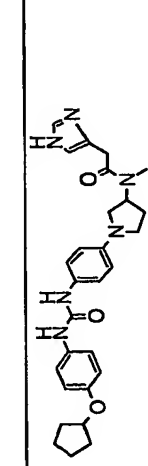
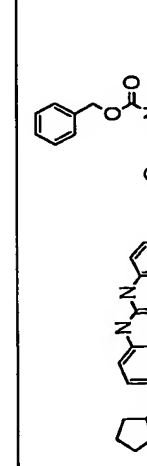
APD62429PC

108		3-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-piperidin-1-carbonsäure tert-butylester	C34H47N5O5	605,78	606
109		5-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-2-oxo-imidazolidin-1-carbonsäure benzyl ester	C35H40N6O6	640,75	641
110		1-Methyl-piperidin-3-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C30H41N5O3	519,69	520
111		2,6-Dioxo-hexahydro-pyrimidin-4-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C28H34N6O5	534,62	535
112		2-Methyl-5-oxo-pyrrolidin-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C29H37N5O4	519,65	520
113		4-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-thiazolidin-3-carbonsäure tert-butylester	C32H43N5O5S	609,79	610

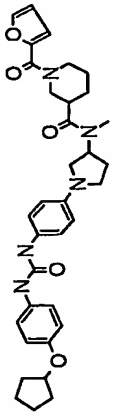
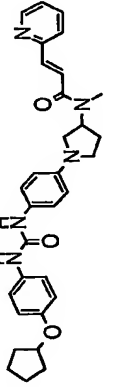
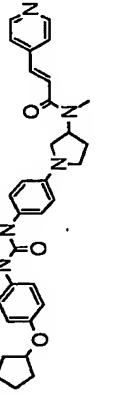
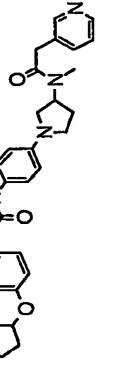
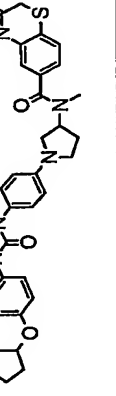
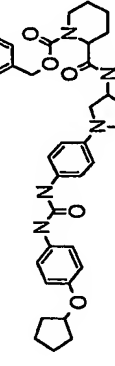
APD62429PC

114		(2S,4R)-4-tert-Butoxy-2-[(1-{4-[3-(4-cyclopentylloxy-phenyl)-ureido]-phenyl})-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbamoyl]-pyrrolidin-1-carbonsäure benzylester	C40H51N5O6	697,88	698
115		N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentylloxy-phenyl)-ureido]-phenyl})-pyrrolidin-3-yl)-3-(2,5-dioxo-pyrrolidin-1-yl)-N-methyl-5-trifluormethyl-benzamid	C35H36F3N5O5	663,70	664
116		2-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentylloxy-phenyl)-ureido]-phenyl})-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbamoyl]-morpholin-4-carbonsäure tert-butylester	C33H45N5O6	607,76	608
117		(R)-1-(Toluene-4-sulfonyl)-pyrrolidin-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentylloxy-phenyl)-ureido]-phenyl})-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C35H43N5O5S	645,83	646
118		{{(3aS,6aS)-2-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentylloxy-phenyl)-ureido]-phenyl})-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbamoyl]-hexahydro-cyclopenta[b]pyrrol-1-yl)-oxo-acetic acid methyl ester	C34H43N5O6	617,75	618

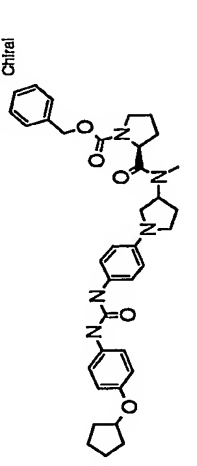
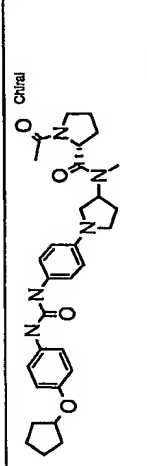
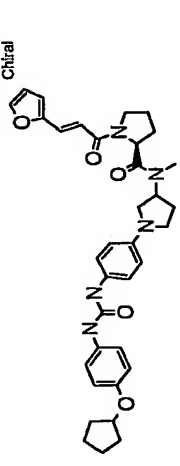
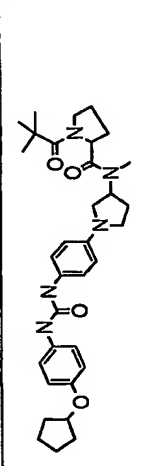
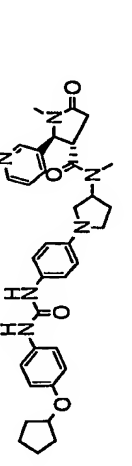
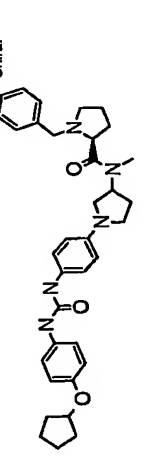
APD62429PC

119		(S)-1-(2,2,2-Trifluor-acetyl)-pyrrolidin-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C30H36F3N5O4	587,65	588
120		2-Chlor-N-[(1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-methyl-benzamid	C32H36ClN5O4	590,13	590
121		N-{1-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-ethyl}-4-methyl-benzamid	C34H41N5O4	583,74	584
122		N-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-methyl}-3,3-dimethyl-butyramid	C31H43N5O4	549,72	550
123		N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-2-(1H-imidazol-4-yl)-N-methyl-acetamid	C28H34N6O3	502,62	503
124		3-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-piperidin-1-carbonsäure benzyl ester	C37H45N5O5	639,80	640

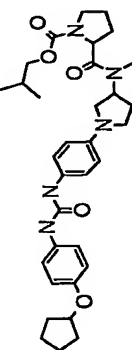
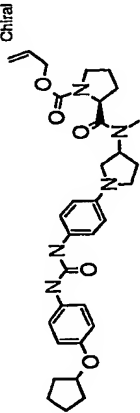
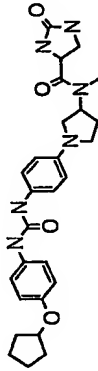
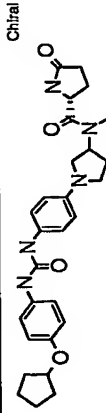
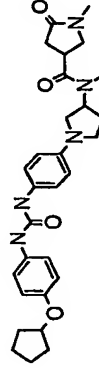
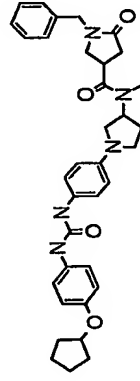
APD62429PC

125		1-(Furan-2-carbonyl)-piperidin-3-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C34H41N5O5	599,74	600
126		(E)-N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-3-pyridin-2-yl-acrylamid	C31H35N5O3	525,66	526
127		(E)-N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-3-pyridin-4-yl-acrylamid	C31H35N5O3	525,66	526
128		N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-2-pyridin-3-yl-acetamid	C30H35N5O3	513,65	514
129		4-Methyl-3-oxo-3,4-dihydro-2H-benzo[1,4]thiazin-6-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C33H37N5O4S	599,76	600
130		2-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-piperidin-1-carbonsäure benzyl ester	C37H45N5O5	639,80	640

APD62429PC

131		(S)-2-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-pyrrolidin-1-carbonsäure benzyl ester	C36H43N5O5	625,77	626
132		(R)-1-Acetyl-pyrrolidin-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C30H39N5O4	533,68	534
133		(S)-1-(E)-3-Furan-2-yl-acryloyl-pyrrolidin-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C35H41N5O5	611,75	612
134		1-(2,2-Dimethyl-propionyl)-pyrrolidin-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C33H45N5O4	575,76	576
135		(trans)-1-Methyl-5-oxo-2-pyridin-3-yl-pyrrolidin-3-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C34H40N6O4	596,74	597
136		(S)-1-Benzyl-pyrrolidin-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C35H43N5O3	581,76	582

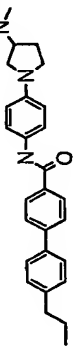
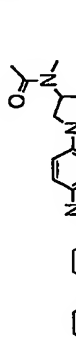

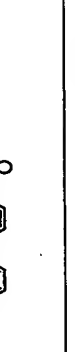
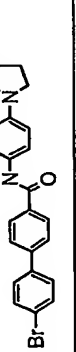
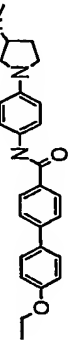
APD62429PC

137		2-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-pyrrolidin-1-carbonsäure isobutylester	C33H45N5O5	591,76	592
138		(S)-2-[(1-{4-[3-(4-Cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbamoyl]-pyrrolidin-1-carbonsäure allyl ester	C32H41N5O5	575,71	576
139		2-Oxo-imidazolidin-4-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C27H34N6O4	506,61	507
140		(R)-5-Oxo-pyrrolidin-2-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C28H35N5O4	505,62	506
141		1-Methyl-5-oxo-pyrrolidin-3-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C29H37N5O4	519,65	520
142		1-Benzyl-5-oxo-pyrrolidin-3-carbonsäure (1-{4-[3-(4-cyclopentyl-oxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-amid	C35H41N5O4	595,75	596

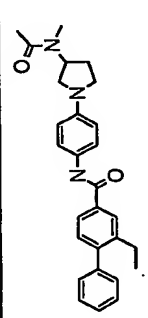
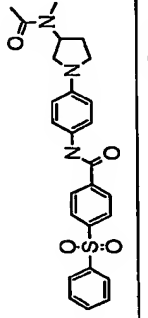
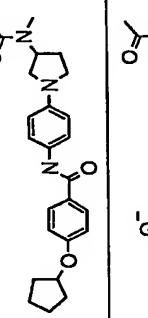
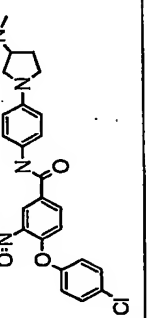
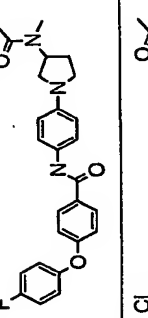
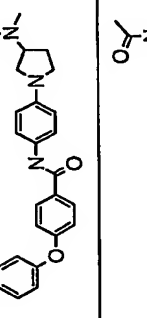
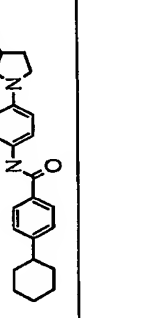




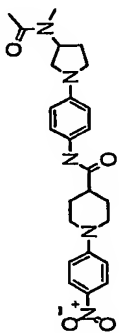
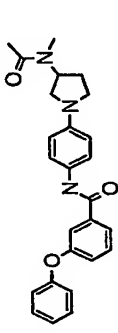
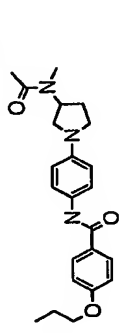
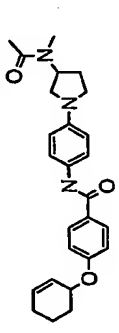
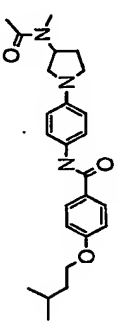
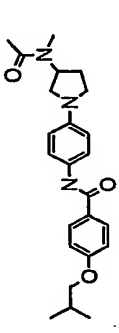
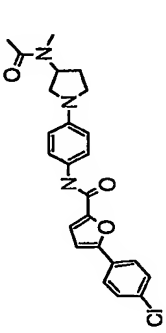
APD62429PC

147		4'-Propyl-biphenyl-4-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C29H33N3O2	455,61	456
148		2'-Fluor-biphenyl-4-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C26H26FN3O2	431,51	432
149		4'-Cyano-biphenyl-4-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C27H26N4O2	438,53	439
150		4'-Brom-biphenyl-4-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C26H26BrN3O2	492,42	492
151		4'-Ethoxy-biphenyl-4-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C28H31N3O3	457,58	458
152		3',4'-Dichlor-biphenyl-4-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C26H25Cl2N3O2	482,41	482

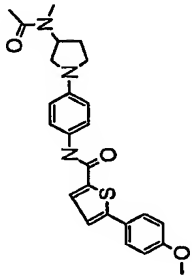
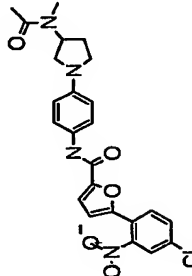
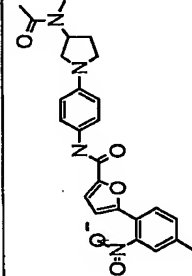
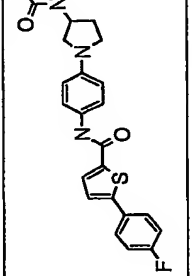
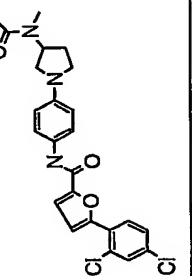
APD62429PC

153		2-Ethyl-biphenyl-4-carbonsäure(4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl)-amid	C28H31N3O2	441,58	442
154		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-benzolsulfonyl-benzamid	C26H27N3O4S	477,59	478
155		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-cyclopentyloxy-benzamid	C25H31N3O3	421,54	422
156		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-(4-chlor-phenoxy)-3-nitro-benzamid	C26H25ClN4O5	508,97	509
157		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-(4-fluor-phenoxy)-benzamid	C26H26FN3O3	447,51	448
158		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-(4-chlor-phenoxy)-benzamid	C26H26ClN3O3	463,97	464
159		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-cyclohexyl-benzamid	C26H33N3O2	419,57	420

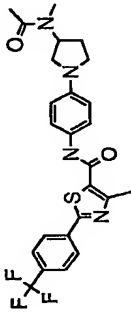
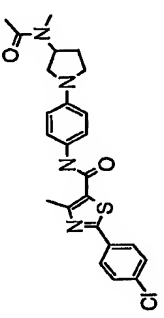
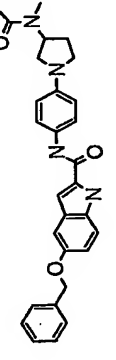
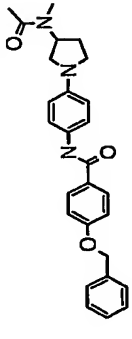
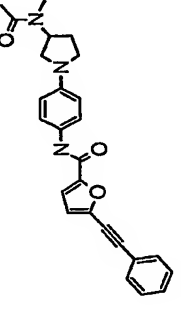
APD62429PC

160		1-(4-Nitro-phenyl)-piperidin-4-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H31N5O4	465,56	466
161		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-3-phenoxy-benzamid	C26H27N3O3	429,52	430
162		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-propoxy-benzamid	C23H29N3O3	395,51	396
163		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-(cyclohex-2-enyloxy)-benzamid	C26H31N3O3	433,56	434
164		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-(3-methyl-butoxy)-benzamid	C25H33N3O3	423,56	424
165		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-isobutoxy-benzamid	C24H31N3O3	409,53	410
166		5-(4-Chlor-phenyl)-furan-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C24H24ClN3O3	437,93	438

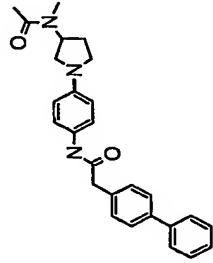
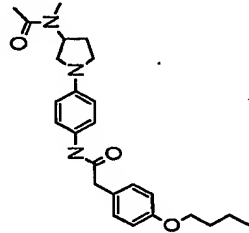
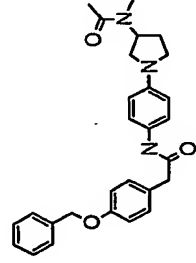
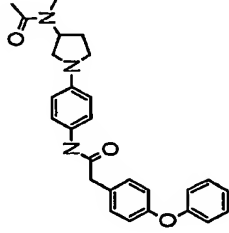
APD62429PC

167		5-(4-Methoxy-phenyl)-thiophene-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H27N3O3S	449,58	450
168		5-(4-Chlor-2-nitro-phenyl)-furan-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C24H23ClN4O5	482,93	483
169		5-(4-Methyl-2-nitro-phenyl)-furan-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H26N4O5	462,51	463
170		5-(4-Fluor-phenyl)-thiophene-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C24H24FN3O2S	437,54	438
171		5-(2,4-Dichlor-phenyl)-furan-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C24H23Cl2N3O3	472,38	472

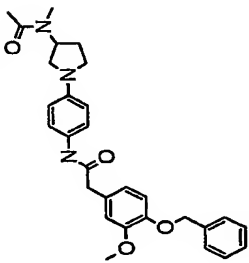
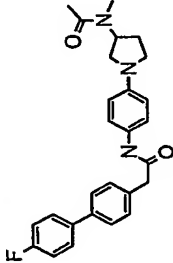
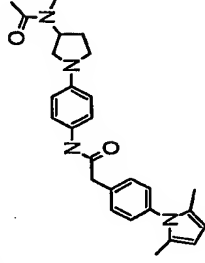
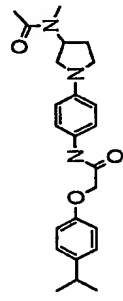
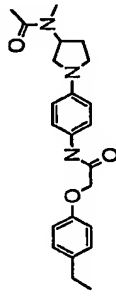
APD62429PC

172		4-Methyl-2-(4-(trifluoromethyl-phenyl))-thiazol-5-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H25F3N4O2 S	502,56	503
173		2-(4-Chlor-phenyl)-4-methyl-thiazol-5-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C24H25ClN4O2 S	469,01	469
174		5-Benzoyloxy-1H-indole-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C29H30N4O3	482,59	483
175		N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-benzoyloxy-benzamid	C27H29N3O3	443,55	444
176		5-Phenylethynyl-furan-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C26H25N3O3	427,51	428

APD62429PC

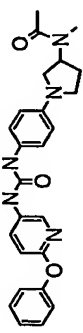
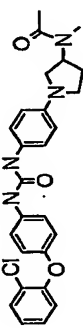
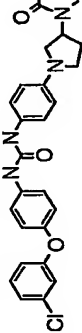
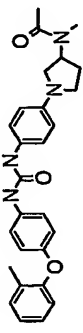
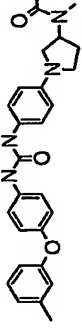
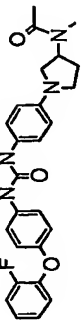
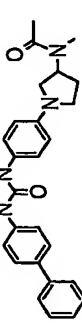
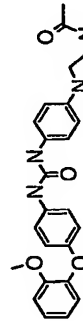
177		N-[4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl]-2-biphenyl-4-yl-acetamid	C27H29N3O2	427,55	428
178		N-[4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl]-2-(4-butoxy-phenyl)-acetamid	C25H33N3O3	423,56	424
179		N-[4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl]-2-(4-benzyloxy-phenyl)-acetamid	C28H31N3O3	457,58	458
180		N-[4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl]-2-(4-phenoxy-phenyl)-acetamid	C27H29N3O3	443,55	444

APD62429PC

181		N-(4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl)-2-(4-benzoyloxy-3-methoxy-phenyl)-acetamid	C29H33N3O4	487,60	488
182		N-(4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl)-2-(4'-fluor-biphenyl-4-yl)-acetamid	C27H28FN3O2	445,54	446
183		N-(4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl)-2-[4-(2,5-dimethyl-pyrrol-1-yl)-phenyl]-acetamid	C27H32N4O2	444,58	445
184		N-(4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl)-2-(4-isopropyl-phenoxy)-acetamid	C24H31N3O3	409,53	410
185		N-(4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl)-2-(4-ethyl-phenoxy)-acetamid	C23H29N3O3	395,51	396

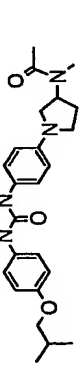
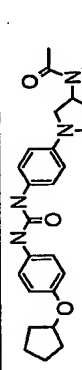
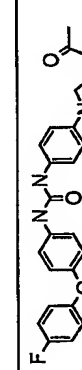
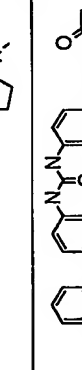

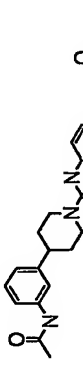
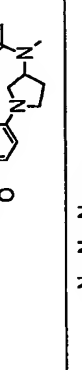
APD62429PC

Tabelle 5

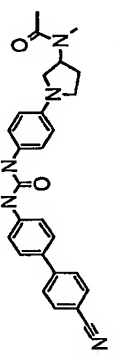
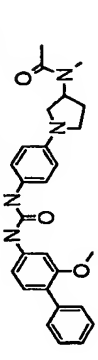
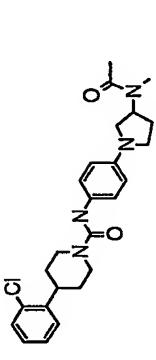
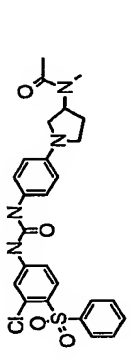
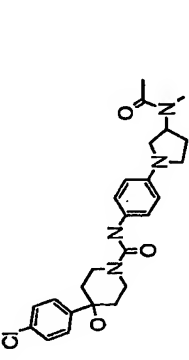
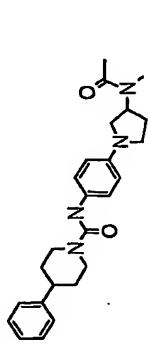
Bsp. No.	Struktur	Name	Summenformel	Molekulargewicht	M+H+
186		N-Methyl-N-(1-{4-[3-(6-phenoxy-pyridin-3-yl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	445,53	446
187		N-[1-(4-{3-[4-(2-Chlor-phenoxy)-phenyl]-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	478,98	479
188		N-[1-(4-{3-[4-(3-Chlor-phenoxy)-phenyl]-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	478,98	479
189		N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-o-tolyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	458,57	459
190		N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-m-tolyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	458,57	459
191		N-[1-(4-{3-[4-(2-Fluor-phenoxy)-phenyl]-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	462,53	463
192		N-[1-[4-(3-Biphenyl-4-yl-ureido)-phenyl]-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid	C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	428,54	429
193		N-[1-(4-{3-[4-(2-Methoxy-phenoxy)-phenyl]-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	474,56	475



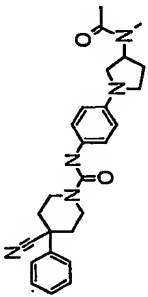
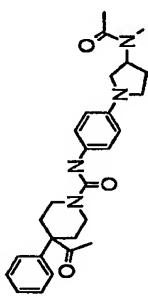
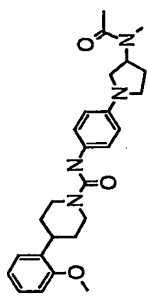
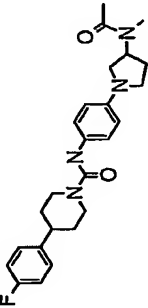
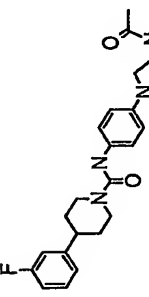
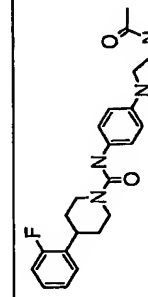
APD62429PC

194		N-(1-{4-[3-(4-Isobutoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C24H32N4O3	424,55	425
195		N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentylloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C25H32N4O3	436,56	437
196		N-[1-(4-[3-[4-(4-Fluor-phenoxy)-phenyl]-ureido]-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid	C26H27FN4O3	462,53	463
197		N-[1-(4-[3-[4-(3-Methoxy-phenoxy)-phenyl]-ureido]-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid	C27H30N4O4	474,56	475
198		4-(3-Acetylamino-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C27H35N5O3	477,61	478
199		N-Methyl-N-(1-{4-[3-(5-phenyl-pyridin-2-yl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C25H27N5O2	429,53	430
200		N-(1-{4-[3-(2-Acetylamino-4-phenylsulfanyl-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C28H31N5O3S	517,65	518

APD62429PC

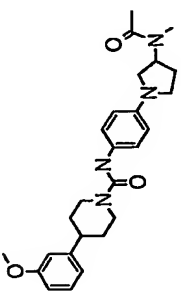
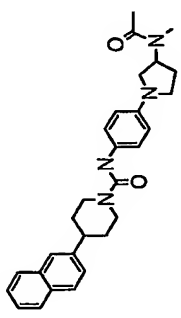
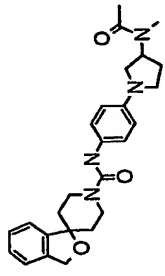
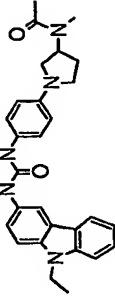
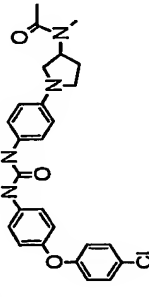
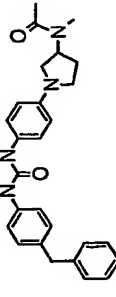
201		N-(1-{4-[3-(4'-Cyano-biphenyl-4-yl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C27H27N5O2	453,55	454
202		N-(1-{4-[3-(2-Methoxy-biphenyl-4-yl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C27H30N4O3	458,57	459
203		4-(2-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H31ClN4O2	455,00	455
204		N-(1-{4-[3-(4-Benzolsulfonyl-3-chlor-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C26H27ClN4O4S	527,05	527
205		4-(4-Chlor-phenyl)-4-hydroxy-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H31ClN4O3	471,00	471
206		4-Phenyl-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H32N4O2	420,56	421

APD62429PC

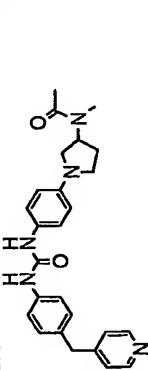
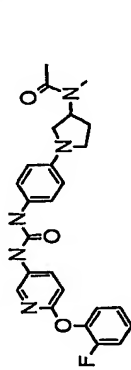
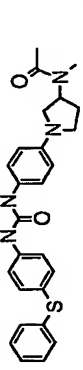
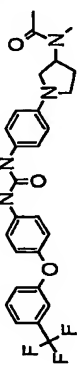
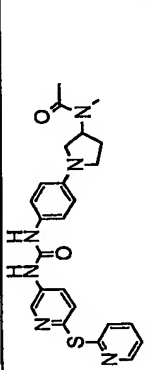
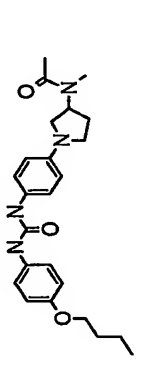
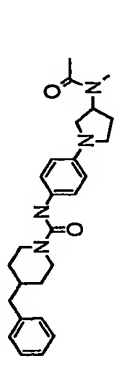
207		4-Cyano-4-phenyl-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C26H31N5O2	445,57	446
208		4-Acetyl-4-phenyl-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C27H34N4O3	462,60	463
209		4-(2-Methoxy-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C26H34N4O3	450,59	451
210		4-(4-Fluorophenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H31FN4O2	438,55	439
211		4-(3-Fluorophenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H31FN4O2	438,55	439
212		4-(2-Fluorophenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H31FN4O2	438,55	439



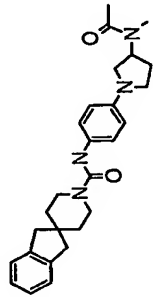
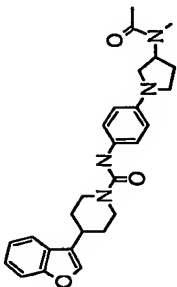
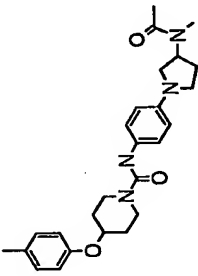
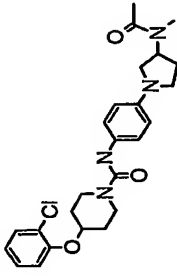
APD62429PC

218		4-(3-Methoxy-phenyl)-piperidin-1-carboxylic acid {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C26H34N4O3	450,59	451
219		4-Naphthalen-2-yl-piperidin-1-carboxylic acid {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C29H34N4O2	470,62	471
220		Benzo[c]-1-Oxa-8-aza-spiro[4.5]decane-8-carboxylic acid {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C26H32N4O3	448,57	449
221		N-(1-{4-[3-(9-Ethyl-9H-carbazol-3-yl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C28H31N5O2	469,59	470
222		N-[1-(4-{3-[4-(4-Chlor-phenoxy)-phenyl]-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C26H27ClN4O3	478,98	479
223		N-(1-{4-[3-(4-Benzyl-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid	C27H30N4O2	442,57	443

APD62429PC

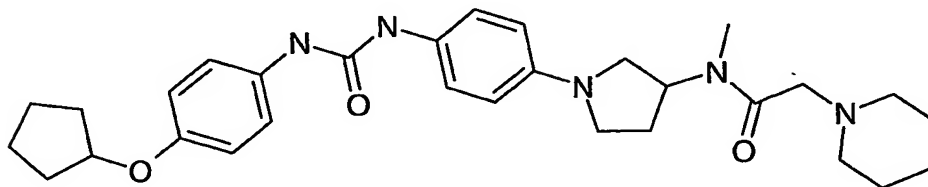
224		N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-pyridin-4-ylmethyl-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C28H30F3N5O4	443,55	444
225		N-[1-(4-{3-[6-(2-Fluor-phenoxy)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-ureidoacetamid	C25H26FN5O3	463,52	464
226		N-Methyl-N-(1-{4-[3-(4-phenylsulfanyl-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C26H28N4O2S	460,60	461
227		N-Methyl-N-[1-(4-{3-[4-(3-trifluormethyl-phenoxy)-phenyl]-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C27H27F3N4O3	512,54	513
228		N-Methyl-N-[1-(4-{3-[6-(pyridin-2-ylsulfanyl)-pyridin-3-yl]-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-acetamid	C26H27F3N6O4S	462,58	463
229		N-(1-{4-[3-(4-Butoxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-ureidoacetamid	C24H32N4O3	424,55	425
230		4-Benzyl-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C26H34N4O2	434,59	435

APD62429PC

231		Benzo-8-aza-spiro[4.5]decan-8-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C27H34N4O2	446,60	447
232		4-Benzofuran-3-yl-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C27H32N4O3	460,58	461
233		4-p-Tolyloxy-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C26H34N4O3	450,59	451
234		4-(2-Chlor-phenoxy)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid	C25H31ClN4O3	471,00	471

## Beispiel 235

N-(1-{4-[3-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-ureido]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-2-piperidin-1-yl-acetamid



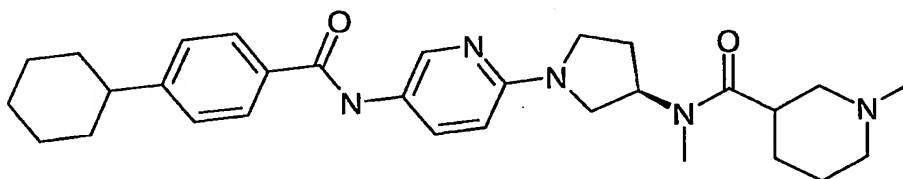
5

Nach Methode E wurde 1-(4-Cyclopentyloxy-phenyl)-3-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-harnstoff mit Piperidin-1-yl-essigsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 519,69 (C<sub>30</sub>H<sub>41</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 520 (M+H<sup>+</sup>).

10

## Beispiel 236

1-Methyl-piperidin-3-carbonsäure {(R)-1-[5-(4-cyclohexyl-benzoylamino)-pyridin-2-yl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-amid



15

Nach Methode E wurde (R)-4-Cyclohexyl-N-[6-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-benzamid mit 1-Methyl-piperidin-3-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 503,69 (C<sub>30</sub>H<sub>41</sub>N<sub>5</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 504 (M+H<sup>+</sup>).

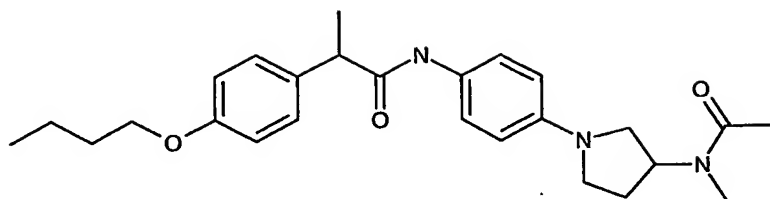
20

## Beispiel 237

N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-butoxy-phenyl)-propionamid



APD62429PC



#### Methode H

Zu einer Lösung von N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-hydroxy-phenyl)-propionamid (27 mg) in DMF (1 mL) wurden Cäsiumcarbonat (36 mg) und n-Butylbromid (15 mg) zugegeben. Nach 2 Stunden Reaktionszeit bei Raumtemperatur wurde der Ansatz mit Wasser versetzt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet, eingeeengt und der Rückstand aus Diethylether/Methanol kristallisiert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 437,59 (C<sub>26</sub>H<sub>35</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 438 (M+H<sup>+</sup>).

10

N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-hydroxy-phenyl)-propionamid

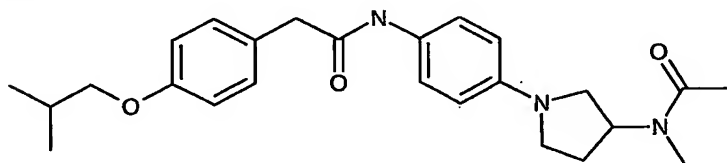
Nach Methode I wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 2-(4-Hydroxyphenyl)-propionsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 381,48 (C<sub>22</sub>H<sub>27</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 382 (M+H<sup>+</sup>).

15

#### Beispiel 238

N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-isobutoxy-phenyl)-acetamid

20



Nach Methode H wurde N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-hydroxy-phenyl)-acetamid mit Isobutylbromid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 423,56 (C<sub>25</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 424 (M+H<sup>+</sup>).

25

APD62429PC

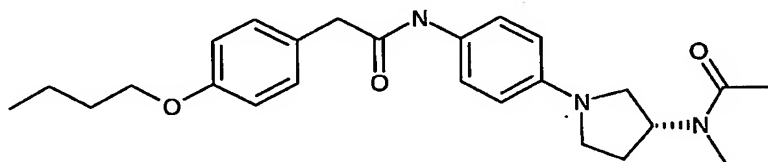
N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-hydroxy-phenyl)-acetamid

Methode I

- 4-Hydroxyphenylessigsäure (305 mg), 1-Hydroxybenzotriazol (300 mg) und 1-(3-Dimethylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimid Hydrochlorid (480 mg) in DMF (5 mL) wurden mit N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid (470 mg) für 3 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann wurde der Ansatz mit Wasser versetzt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde mit ges. Natriumchloridlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, eingeeengt und aus Diethylether kristallisiert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 367,45 (C<sub>21</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 368 (M+H<sup>+</sup>).

Beispiel 239

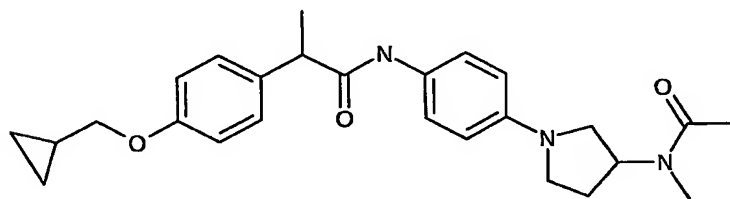
- (R)-N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-butoxy-phenyl)-acetamid



- Nach Methode E wurde (R)-N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 4-Butoxyphenylessigsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 423,56 (C<sub>25</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 424 (M+H<sup>+</sup>).

Beispiel 240

- N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-cyclopropylmethoxy-phenyl)-propionamid



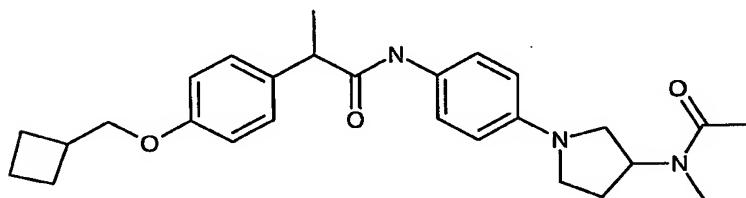
APD62429PC

Nach Methode H wurde N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-hydroxy-phenyl)-propionamid mit Brommethylcyclopropan umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 435,57 (C<sub>26</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 436 (M+H<sup>+</sup>).

5

## Beispiel 241

N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-cyclobutylmethoxy-phenyl)-propionamid



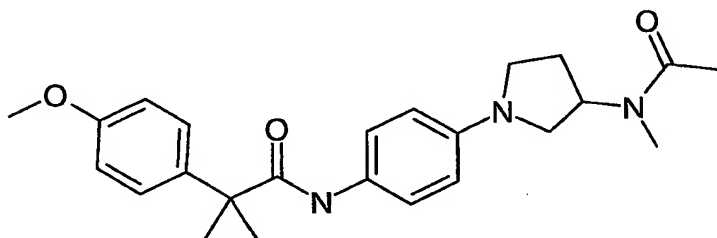
10

Nach Methode H wurde N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-2-(4-hydroxy-phenyl)-propionamid mit Brommethylcyclobutan umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 449,60 (C<sub>27</sub>H<sub>35</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 450 (M+H<sup>+</sup>).

15

## Beispiel 242

1-(4-Methoxy-phenyl)-cyclopropanecarbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid



20

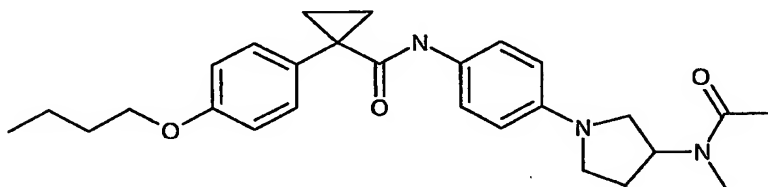
Nach Methode E wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 1-(4-Methoxyphenyl)-1-cyclopropanecarbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 407,52 (C<sub>24</sub>H<sub>29</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 408 (M+H<sup>+</sup>).

25

APD62429PC

## Beispiel 243

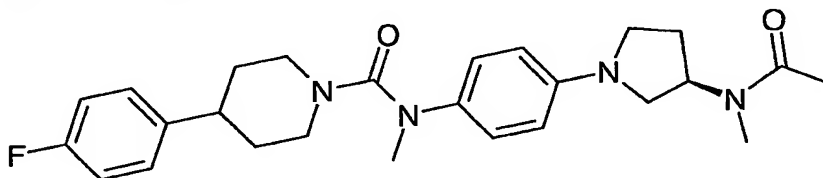
1-(4-Butoxy-phenyl)-cyclopropanecarbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid



- 5 Nach Methode H wurde 1-(4-Hydroxy-phenyl)-cyclopropanecarbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid mit n-Butylbromid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 449,60 (C<sub>27</sub>H<sub>35</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 450 (M+H<sup>+</sup>).
- 10 1-(4-Hydroxy-phenyl)-cyclopropanecarbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid  
Zu einer Lösung von 1-(4-Methoxy-phenyl)-cyclopropanecarbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid (540 mg) in Dichlormethan (5,5 mL) wurde bei 0°C Bortribromid-Dimethylsulfid (460 mg) zugegeben. Nach 12 Stunden
- 15 Reaktionszeit bei Raumtemperatur wurde der Ansatz mit Wasser versetzt, die Phasen getrennt und die wäßrige Phase mit Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet, eingeeengt und durch Chromatographie (Kieselgel, Toluol/Ethanol/Ethylacetat 8:1:1 unter Zusatz von 0,1% Triethylamin) gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem
- 20 Molekulargewicht 393,49 (C<sub>23</sub>H<sub>27</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 394 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 244

- (R)-4-(4-Fluor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-N-methyl-amid
- 25



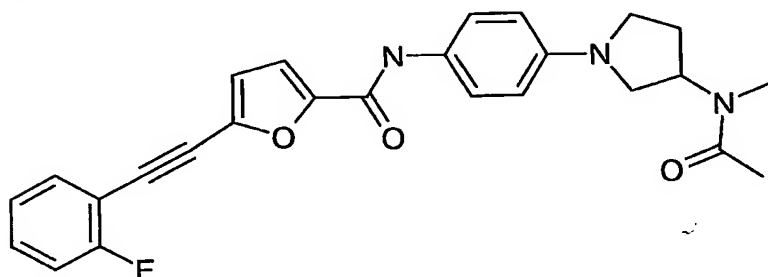
APD62429PC

- Eine Suspension von Natriumhydrid (95%ig in Öl; 0,005 g) in DMF (1 mL) wurde mit (*R*)-4-(4-Fluor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid (22 mg) versetzt. Nach beendeter Gasentwicklung wurde Iodmethan (0,02 mL) zugesetzt. Nach zwei Stunden wurde die
- 5 Reaktionsmischung vorsichtig mit Wasser hydrolysiert und mit Dichlormethan extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt und der Rückstand aus Pentan kristallisiert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 452,58 (C<sub>26</sub>H<sub>33</sub>FN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 453 (M+H<sup>+</sup>).

10

## Beispiel 245

5-2-[(2-Fluor-phenyl)-ethinyl]-furan-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid



## 15 Methode J

- Unter inerten Bedingungen wurden zu einer Suspension von Palladium bis(tri-tert.-butylphosphin)dichlorid (3,8 mg) und Kupfer(I)-iodid (0,9 mg) in DMF (0,5 mL) zunächst Diisopropylamin (14,9 mg) und dann eine Lösung von 5-Bromfuran-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid (50,0 mg)
- 20 und 1-Ethinyl-2-fluorbenzol (17,7 mg) in Dioxan (0,5 mL) und DMF (0,2 mL) zugegeben. Nach 12 Stunden Reaktionszeit bei Raumtemperatur wurde mit Ethylacetat verdünnt, über Kieselgel filtriert, das Filtrat eingeeengt und über präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 445,18 (C<sub>26</sub>H<sub>24</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 446 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

25

5-Bromfuran-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid

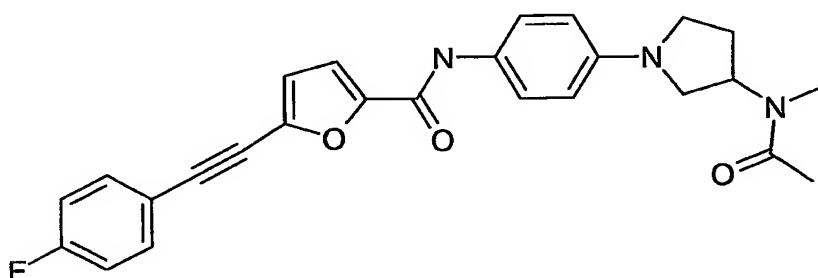
APD62429PC

Nach Methode E wurde N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid mit 5-Brom-2-furancarbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 406,28 (C<sub>18</sub>H<sub>20</sub>BrN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 407 (M+H<sup>+</sup>).

5

## Beispiel 246

5-2-[(4-Fluor-phenyl)-ethinyl]-furan-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid

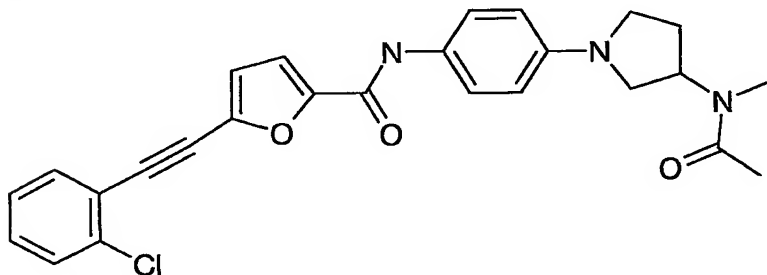


- 10 Nach Methode J wurde 5-Bromfuran-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid mit 1-Ethinyl-4-fluorbenzol umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 445,18 (C<sub>26</sub>H<sub>24</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 446 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

15

## Beispiel 247

5-2-[(2-Chlor-phenyl)-ethinyl]-furan-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid



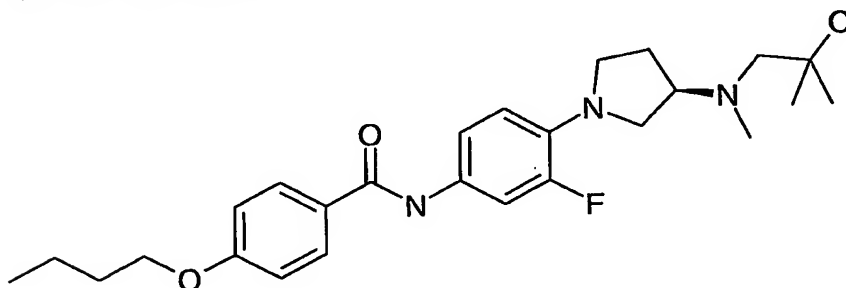
- 20 Nach Methode J wurde 5-Bromfuran-2-carbonsäure{4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid mit 1-Ethinyl-2-chlorbenzol umgesetzt. Man erhielt so

APD62429PC

das Produkt mit dem Molekulargewicht 461,15 (C<sub>26</sub>H<sub>24</sub>ClN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS(ESI): 462 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

## 5 Beispiel 248

R-4-Butoxy-N-(3-fluor-4-{3-[(2-hydroxy-2-methyl-propyl)-methyl-amino]-pyrrolidin-1-yl}-phenyl)-benzamid

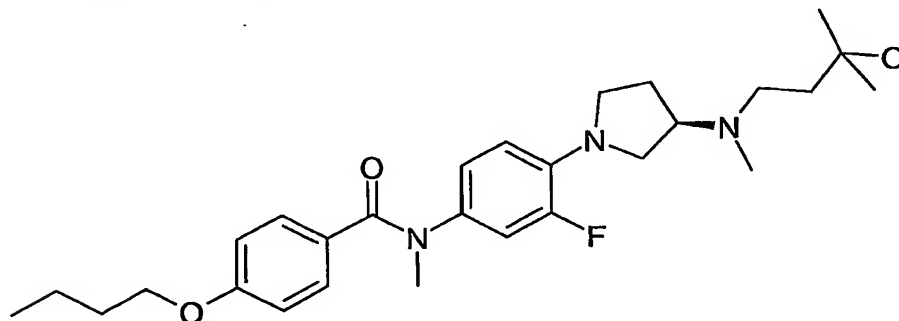


10 Eine Lösung von (R)-4-Butoxy-N-[3-fluor-4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid (0,03 g) und Isobutyleneoxid in Ethanol (5 mL) wurden 3 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Anschließend wurde im Vakuum eingengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 457,59 (C<sub>26</sub>H<sub>36</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 458 (M+H<sup>+</sup>).

15

## Beispiel 249

R-4-Butoxy-N-(3-fluor-4-{3-[(3-hydroxy-3-methyl-butyl)-methyl-amino]-pyrrolidin-1-yl}-phenyl)-N-methyl-benzamid



20 Eine Lösung von (R)-4-Butoxy-N-[3-fluor-4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid (0,03 g), Triethylamin (0,02 g) und 4-Brom-2-methyl-butan-2-ol (0,03 g)

APD62429PC

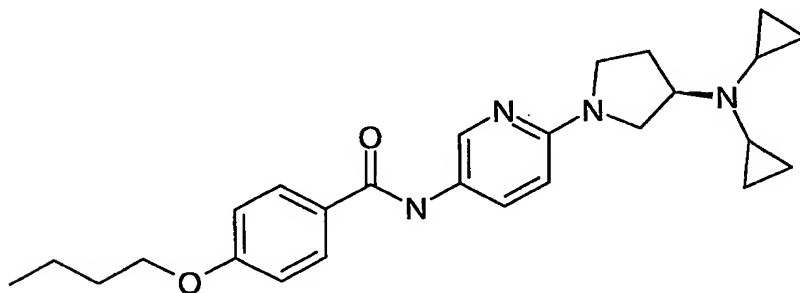
in DMF (2 mL) wurde 16 Stunden auf 80 °C erwärmt. Nach dem Abkühlen wurde Ethylacetat (100 mL) hinzugegeben, mit Wasser (2 x 50 mL) gewaschen, die organische Phase mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Der Rückstand wurde mit präparativer HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 471,62 (C<sub>27</sub>H<sub>38</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 472 (M+H<sup>+</sup>).

#### 4-Brom-2-methyl-butan-2-ol

Eine Lösung von 3-Brompropionsäure-ethylester (10 g) in Diethylether (100 mL) wurde bei Raumtemperatur unter Argon mit Methylmagnesiumbromid (3M in Diethylether; 46 mL) versetzt. Hierbei wurde der Ansatz über 20 °C und unter 35 °C gehalten. Nach 2 Stunden wurde die Mischung auf eine gesättigte Ammoniumchloridlösung gegossen. Dann wurde mit Diethylether extrahiert, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Man erhielt so das gewünschte Produkt.

#### Beispiel 250

R-4-Butoxy-N-[6-(3-dicyclopropylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-benzamid



#### 20 Methode K

Eine Lösung aus (R)-N-[6-(3-Amino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-4-butoxybenzamid (0,065 g) in Methanol (2 mL) wurde mit Eisessig (0,11 mL), und [(1-ethoxycyclopropyl)-oxy]-trimethylsilan (0,19 g) versetzt. Anschließend wurde Natriumcyanoborhydrid (0,051 g) zugegeben und 16 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Dann wurde die Mischung filtriert, konzentriert, in Dichlormethan aufgenommen, mit Natriumhydroxid (2N; 20 mL) und Natriumchloridlösung (20 mL) gewaschen, mit Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand

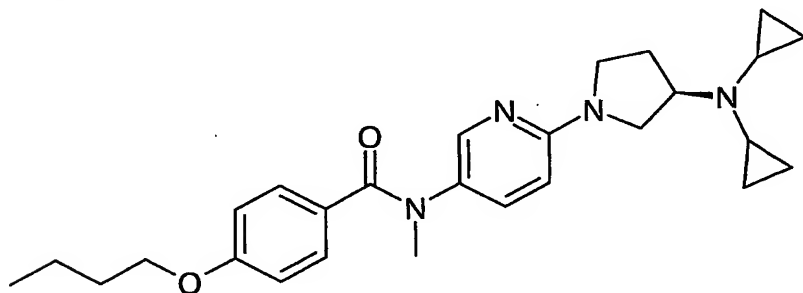


APD62429PC

wurde mit präparativer HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 434,59 (C<sub>26</sub>H<sub>34</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 435 (M+H<sup>+</sup>).

## 5 Beispiel 251

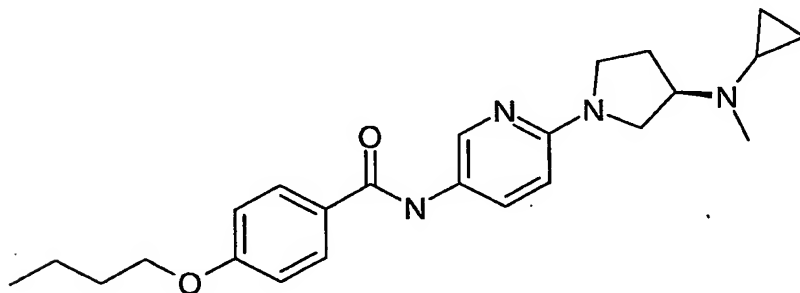
R-4-Butoxy-N-[6-(3-dicyclopropylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-N-methylbenzamid



10 Nach Methode F wurde (R)-4-Butoxy-N-[6-(3-dicyclopropylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-benzamid methyliert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 448,61 (C<sub>27</sub>H<sub>36</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 449 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 252

15 R-4-Butoxy-N-{6-[3-(cyclopropyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-pyridin-3-yl}-benzamid

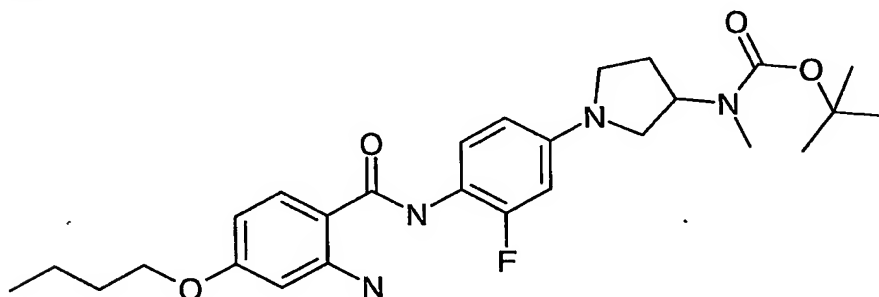


20 Nach Methode K wurde (R)-4-Butoxy-N-[6-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-benzamid cyclopropyliert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 408,551 (C<sub>24</sub>H<sub>32</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 409 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

## Beispiel 253

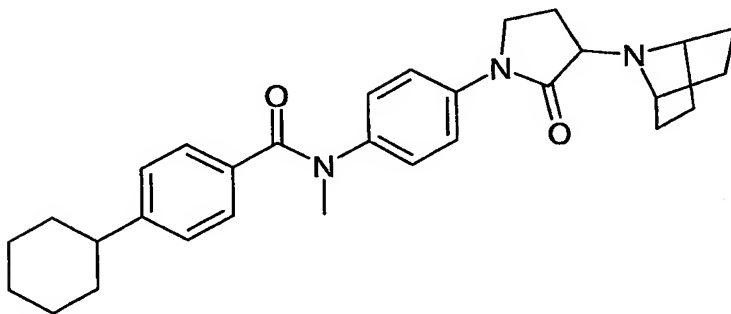
{1-[4-(2-Amino-4-butoxy-benzoylamino)-3-fluor-phenyl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-carbaminsäure tert-butylester



- 5 Nach Methode E wurde [1-(4-Amino-3-fluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester mit 4-Butoxy-2-nitro-benzoesäure umgesetzt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 500,62 (C<sub>27</sub>H<sub>37</sub>FN<sub>4</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 501 (M+H<sup>+</sup>).
- 10 4-Butoxy-2-nitro-benzoesäure  
Eine Lösung aus 4-Fluor-2-nitro-benzoesäure (1,81 g) in Butanol (20 mL) wurde mit Schwefelsäure (3 mL) versetzt und 4 Stunden bei 110 °C gerührt. Es wurde Ethylacetat (100 mL) hinzugefügt, mit gesättigter Natriumhydrogencarbonat Lösung (3 x 50 mL) gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und im
- 15 Vakuum eingeeengt. Der Rückstand (2,2 g) wurde bei -10 °C zu einer Natriumbutoxyat Lösung, hergestellt aus Butanol (20 mL) und Natriumhydrid (2,18 g) bei -10 °C, unter Argon zugetropft und anschließend 20 Stunden gerührt. Es wurde Ethylacetat (100 mL) hinzugegeben, mit Wasser (2 x 50 mL) gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und im Vakuum eingeeengt. Der Rückstand
- 20 wurde mit präparativer HPLC gereinigt. Der 4-Butoxy-2-nitro-benzoesäurebutylester wurde bei Raumtemperatur über 3 Stunden mit Natriumhydroxid (5N; 100 mL) in Ethanol verseift. Es wurde mit Salzsäure (10N; 100 mL) sauer gestellt, mit Dichlormethan extrahiert, die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und konzentriert. Man erhielt so das Produkt mit
- 25 dem Molekulargewicht 239,23 (C<sub>11</sub>H<sub>13</sub>NO<sub>5</sub>); MS (ESI): 240 (M+H<sup>+</sup>).

### Beispiel 254

N-{4-[3-(7-Aza-bicyclo[2.2.1]hept-7-yl)-2-oxo-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid



## 5 Methode L

Eine Mischung von N-[4-(3-Brom-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid (100 mg), Kaliumcarbonat (60 mg), 7-Aza-bicyclo[2.2.1]heptan (44 mg) und DMF (2 mL) wurde für 6 Stunden bei 50°C gehalten. Die Mischung wurde mit Wasser verdünnt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 471,65 (C<sub>30</sub>H<sub>37</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 472 (M+H<sup>+</sup>).

N-[4-(3-Brom-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid  
N-(4-Amino-phenyl)-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid (3,0 g) in Acetonitril (30 mL)  
wurde mit Trinatriumphosphat (0,95 g) versetzt und bei 0°C 2-Brom-4-  
chlorbutyrylbromid (2,9 g) zugesetzt. Nach einer Stunde wurde eine Lösung von  
Natriumhydroxid (0,85 g) in Wasser (10 mL) zugesetzt und die Mischung 6  
Stunden bei Raumtemperatur intensiv gerührt. Danach wurde die gleiche Menge  
Natronlauge zugesetzt und weitere 48 Stunden gerührt. Die Reaktionslösung  
wurde mit Wasser verdünnt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase  
wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde  
durch Chromatographie an Kieselgel (Laufmittel Ethylacetat/Heptan 1:2) gereinigt.  
Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 455,40 (C<sub>24</sub>H<sub>27</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>);  
MS (ESI): 456 (M+H+).

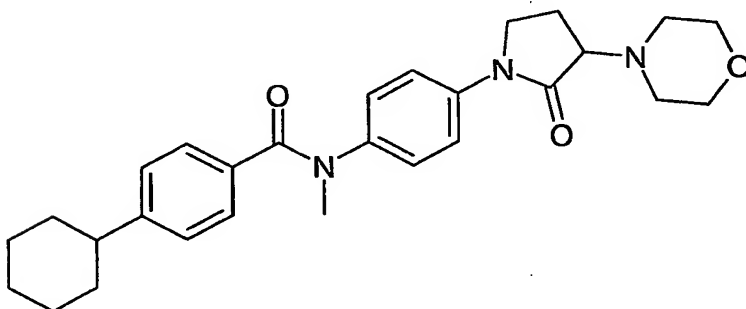
**N-(4-Amino-phenyl)-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid**

APD62429PC

- 4-Cyclohexylcarbonsäure (5,0 g) und 4-Nitrophenylisocyanat (4,0 g) wurden in Toluol (150 mL) für 3 Stunden gerührt und dann über Nacht stehen gelassen. Der Niederschlag wurde abgesaugt und mit Diethylether gewaschen. Das erhaltene Amid wurde nach Methode F methyliert und nach Methode B hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 308,43 (C<sub>20</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O); MS (ESI): 309 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 255

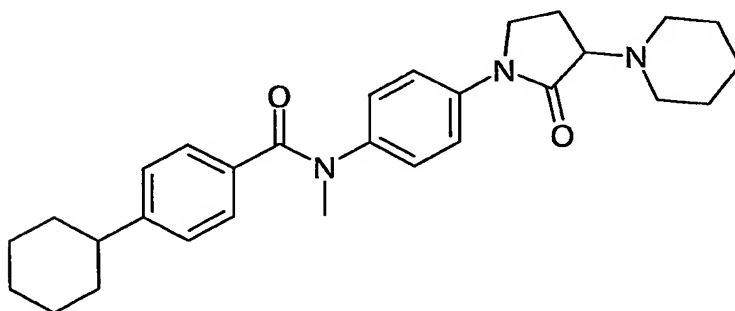
- 4-Cyclohexyl-N-methyl-N-[4-(3-morpholin-4-yl-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid



- Nach Methode L wurde N-[4-(3-Brom-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid mit Morpholin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 461,61 (C<sub>28</sub>H<sub>35</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 462 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 256

- 4-Cyclohexyl-N-methyl-N-[4-(2-oxo-3-piperidin-1-yl-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid



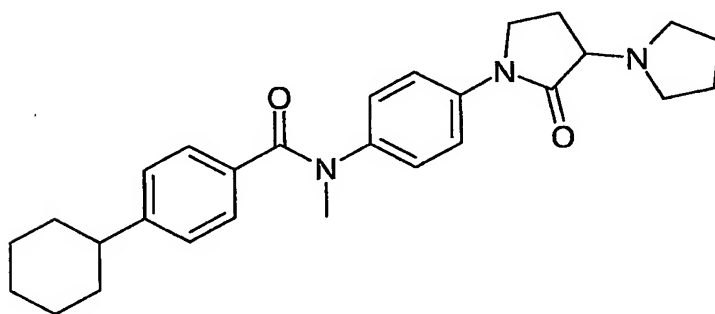
APD62429PC

Nach Methode L wurde N-[4-(3-Brom-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid mit Piperidin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 459,64 (C<sub>29</sub>H<sub>37</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 460 (M+H<sup>+</sup>).

5

## Beispiel 257

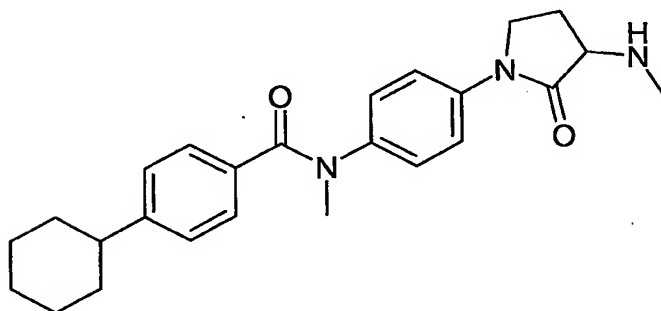
4-Cyclohexyl-N-methyl-N-[4-(2'-oxo-[1,3'']bipyrrolidiny-1'-yl)-phenyl]-benzamid



10 Nach Methode L wurde N-[4-(3-Brom-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid mit Pyrrolidin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 445,61 (C<sub>28</sub>H<sub>35</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 446 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 258

15 4-Cyclohexyl-N-methyl-N-[4-(3-methylamino-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid

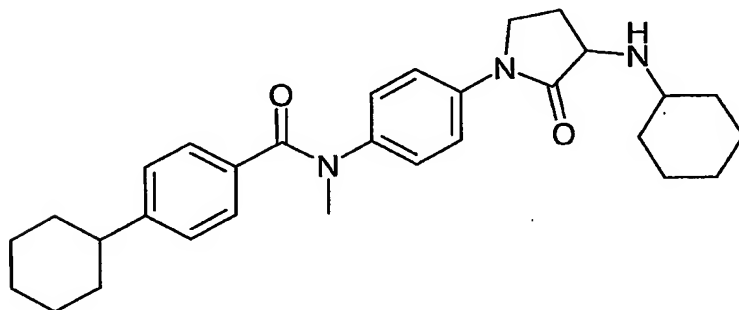


20 Nach Methode L wurde N-[4-(3-Brom-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid mit Methylamin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 405,54 (C<sub>25</sub>H<sub>31</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 406 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

## Beispiel 259

4-Cyclohexyl-N-[4-(3-cyclohexylamino-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-N-methyl-  
benzamid

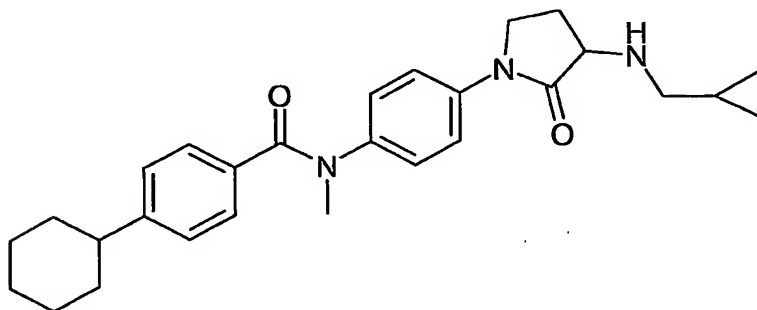


Nach Methode L wurde N-[4-(3-Brom-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid mit Cyclohexylamin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 473,66 (C<sub>30</sub>H<sub>39</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 474 (M+H<sup>+</sup>).

10

## Beispiel 260

4-Cyclohexyl-N-[4-[3-(cyclopropylmethyl-amino)-2-oxo-pyrrolidin-1-yl]-phenyl]-N-methyl-benzamid



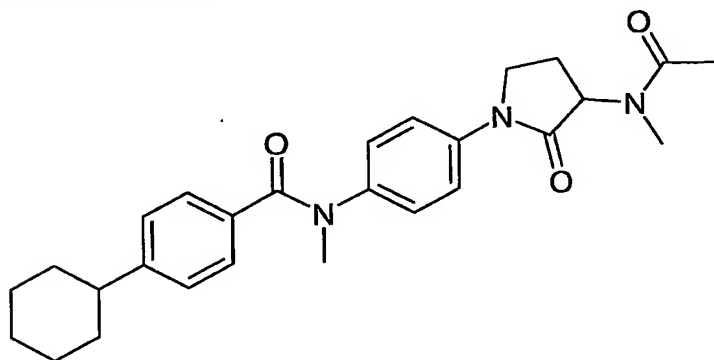
15

Nach Methode L wurde N-[4-(3-Brom-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid mit Cyclopropylmethylamin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 445,61 (C<sub>28</sub>H<sub>35</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 446 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

## Beispiel 261

N-{4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-2-oxo-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid



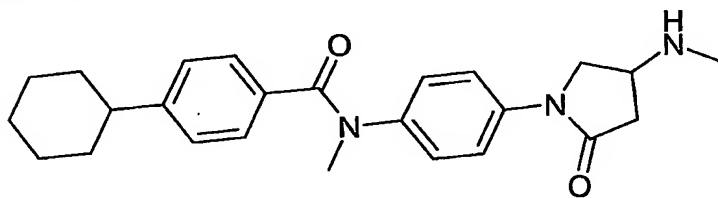
5

4-Cyclohexyl-N-methyl-N-[4-(3-methylamino-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid (52 mg) wurde mit Pyridin (0.5 mL) und Acetanhydrid (130 mg) versetzt und nach 3 Stunden flüchtige Anteile im Vakuum entfernt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 447,58 (C<sub>27</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 448 (M+H<sup>+</sup>).

10

## Beispiel 262

4-Cyclohexyl-N-methyl-N-[4-(4-methylamino-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid



15 1-[4-[(4-Cyclohexyl-benzoyl)-methyl-amino]-phenyl]-5-oxo-pyrrolidin-3-carbonsäure (1,5 g) wurde mit tert-Butanol (8 mL), Triethylamin (350 mg) und schliesslich mit Diphenylphosphorylazid (1,18 g) versetzt und für 48 Stunden auf 95°C erhitzt. Die Reaktionslösung wurde mit Ethylacetat verdünnt und zweimal mit Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat  
20 getrocknet und eingeeengt. Das Rohprodukt wurde nach Methode G weiter

APD62429PC

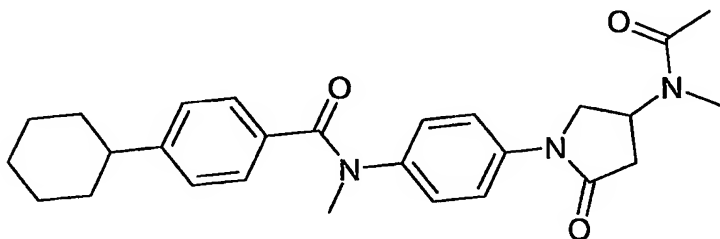
umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 405,54 (C<sub>25</sub>H<sub>31</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 406 (M+H<sup>+</sup>).

1-{4-[(4-Cyclohexyl-benzoyl)-methyl-amino]-phenyl}-5-oxo-pyrrolidin-3-carbonsäure

N-(4-Amino-phenyl)-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid (3,0 g) wurde mit Itaconsäure (1,27 g) für 3 Stunden auf 100 °C erwärmt. Die Reinigung erfolgte durch Filtration über Kieselgel (Laufmittel Ethylacetat/Methanol 5:1). Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 420,51 (C<sub>25</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 421 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 263

N-{4-[4-(Acetyl-methyl-amino)-2-oxo-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-4-cyclohexyl-N-methyl-benzamid



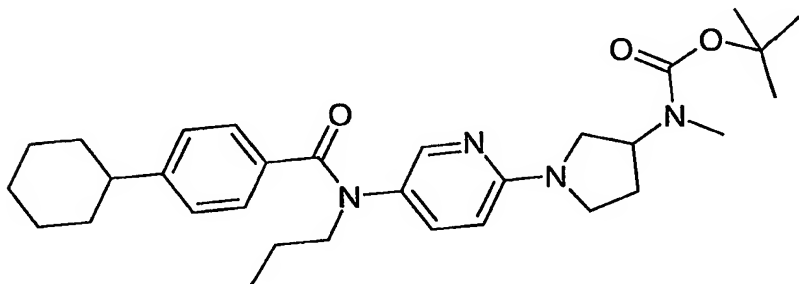
4-Cyclohexyl-N-methyl-N-[4-(4-methylamino-2-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid (101 mg) wurde mit Pyridin (20mg) und Acetanhydrid (25 mg) versetzt und nach 3 Stunden flüchtige Anteile im Vakuum entfernt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 447,58 (C<sub>27</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 448 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 264



APD62429PC

(1-{5-[(4-Cyclohexyl-benzoyl)-propyl-amino]-pyridin-2-yl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäure tert-butylester



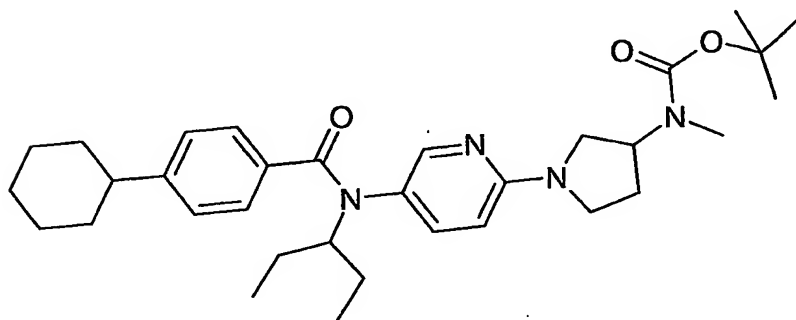
#### Methode F-a

- 5 {1-[5-(4-Cyclohexyl-benzoylamino)-pyridin-2-yl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-carbaminsäure tert-butylester (50 mg), Cäsiumcarbonat (249 mg), Kaliumiodid (17 mg), N-Methylpyrrolidon (1,5 mL) und Propyliodid (40 mg) wurden für 5 Stunden bei 60°C gerührt. War der Umsatz unvollständig wurde auf 100°C erhitzt, weiteres Propyliodid (40 mg) zugegeben und für 12 Stunden auf 140°C erhitzt. Das
- 10 Reaktionsgemisch wurde mit Ethylacetat verdünnt, mit Wasser und Natriumhydrogencarbonatlösung gewaschen, über Chromabond XTR getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 520,72 (C<sub>31</sub>H<sub>44</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 521 (M+H<sup>+</sup>).

15

#### Beispiel 265

(1-{5-[(4-Cyclohexyl-benzoyl)-(1-ethyl-propyl)-amino]-pyridin-2-yl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäure tert-butylester



20

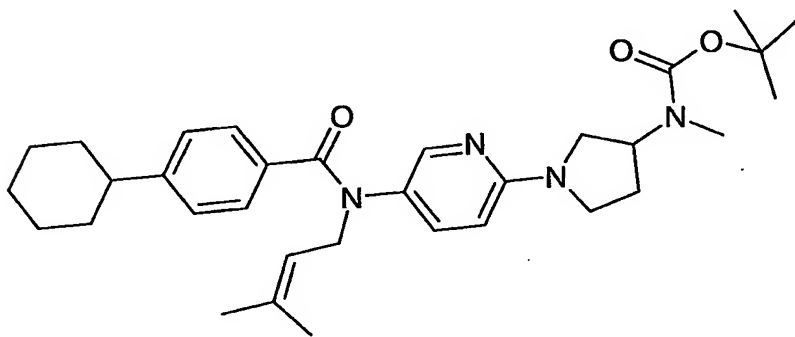
APD62429PC

Nach Methode F-a wurde {1-[5-(4-Cyclohexyl-benzoylamino)-pyridin-2-yl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-carbaminsäure tert-butylester mit 2-Ethylbutylbromid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 548,78 (C<sub>33</sub>H<sub>48</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 549 (M+H<sup>+</sup>).

5

**Beispiel 266**

(1-{5-[(4-Cyclohexyl-benzoyl)-(3-methyl-but-2-enyl)-amino]-pyridin-2-yl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäure tert-butylester



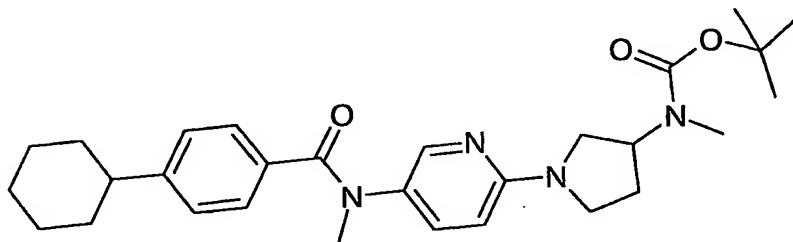
10

Nach Methode F-a wurde {1-[5-(4-Cyclohexyl-benzoylamino)-pyridin-2-yl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-carbaminsäure tert-butylester mit 3-Methyl-2-butenylbromid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 546,76 (C<sub>33</sub>H<sub>46</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 547 (M+H<sup>+</sup>).

15

**Beispiel 267**

(1-{5-[(4-Cyclohexyl-benzoyl)-methyl-amino]-pyridin-2-yl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäure tert-butylester



20

APD62429PC

Nach Methode F-a wurde {1-[5-(4-Cyclohexyl-benzoylamino)-pyridin-2-yl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-carbaminsäure tert-butylester mit Methyljodid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 492,67 (C<sub>29</sub>H<sub>40</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 493 (M+H<sup>+</sup>).

- 5 Weiter wurden nach Methode F-a aus {1-[5-(4-Cyclohexyl-benzoylamino)-pyridin-2-yl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-carbaminsäure tert-butylester und dem entsprechenden Alkylierungsmittel folgende Verbindungen erhalten:

(1-{5-[sec-Butyl-(4-cyclohexyl-benzoyl)-amino]-pyridin-2-yl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäure tert-butylester

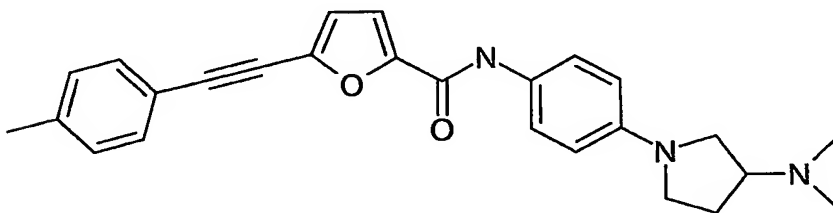
- 10 (1-{5-[(4-Cyclohexyl-benzoyl)-isopropyl-amino]-pyridin-2-yl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäure tert-butylester

(1-{5-[(4-Cyclohexyl-benzoyl)-prop-2-ynyl-amino]-pyridin-2-yl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäure tert-butylester

15

#### Beispiel 268

5-p-Tolylethynyl-furan-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



20

- Unter Argon wurden zu 3,8 mg Pd(tBu)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> und 0,95 mg CuI in 0,2 mL DMF 0,042 mL Diisopropylamin gegeben. Anschließend wurden eine Lösung aus 94,6 mg 5-Brom-furan-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid in 0,3 mL DMF und eine Lösung aus 4-Ethynyltoluol in 0,3 mL DMF zugetropft. Die
- 25

APD62429PC

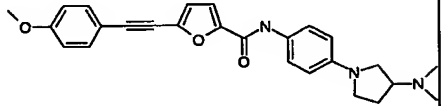
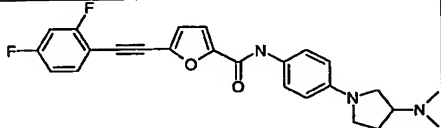
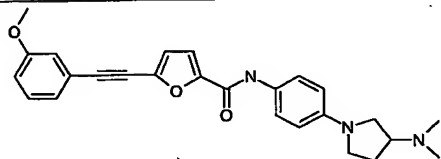
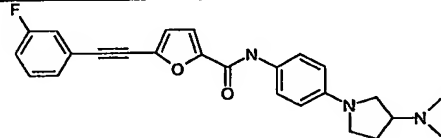
Lösung wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Der ausgefallene Niederschlag abgesaugt und das Filtrat durch präparative HPLC gereinigt. Das gewünschte Produkt mit dem Molekulargewicht 413,52; MS (ESI): 414 wurde als Hydrotrifluoracetat erhalten.

5

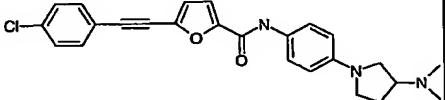
5-Brom-furan-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid  
Nach Methode E wurde [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin mit 5-Brom-2-furancarbonsäure umgesetzt. Es wurde das Produkt mit einem Molekulargewicht von 378,27 (C<sub>17</sub>H<sub>20</sub>BrN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 379 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat erhalten.

10

Analog wurden die Beispiele 269-273 dargestellt:

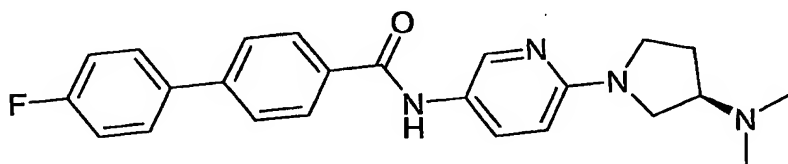
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Molekulargewicht	M+H <sup>+</sup>
269		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	429,21	430
270		C <sub>25</sub> H <sub>23</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	435,18	436
271		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	429,21	430
272		C <sub>25</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	417,19	418

APD62429PC

273		C <sub>25</sub> H <sub>24</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	433,16	434
-----	---	---	--------	-----

## Beispiel 274

(R)-4'-Fluor-biphenyl-4-carbonsäure [6-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-amid



## Methode M

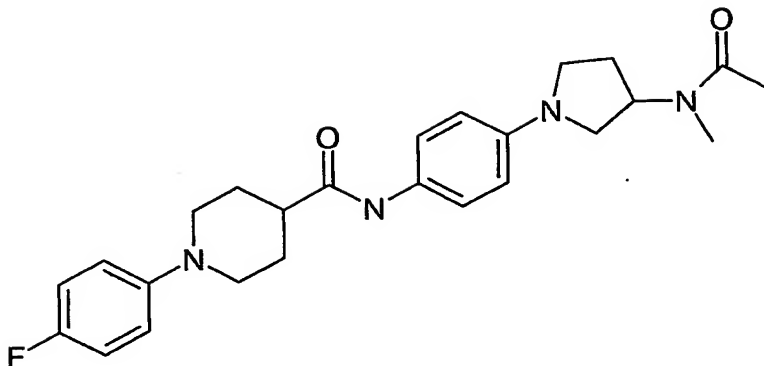
(R)-4'-Fluor-biphenyl-4-carbonsäure [6-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-amid (390 mg) gelöst in Ameisensäure (230 mg) wurde mit Formaldehydlösung (37% aq.; 0.4 mL) versetzt und die Mischung für 3 Stunden auf 80°C erwärmt. Die abgekühlte Reaktionslösung wurde eingeeengt und zwischen Ethylacetat und einer gesättigten Natriumcarbonatlösung verteilt. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das Rohprodukt wurde durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht

404,49 (C<sub>24</sub>H<sub>25</sub>FN<sub>4</sub>O); MS (ESI): 405 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 275

1-(4-Fluor-phenyl)-piperidin-4-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid

APD62429PC



## Methode E-a

Eine Mischung aus 0,048 g 1-(4-Fluor-phenyl)-piperidin-4-carbonsäure und 0,5 mL  $\text{SOCl}_2$  und einem Tropfen DMF wurden 2 Stunden bei Raumtemperatur gerührt.

- 5 Anschließend wurde das überschüssige  $\text{SOCl}_2$  im Vakuum entfernt. Der Rückstand wurde in 0,4 mL DMF gelöst und mit 0,033 mL Triethylamin und 0,048 g N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid versetzt. Die Lösung wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Danach wurde die Lösung abfiltriert und über präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem
- 10 Molekulargewicht 438,20 ( $\text{C}_{25}\text{H}_{31}\text{FN}_4\text{O}_2$ ); MS (ESI): 439 ( $\text{M}+\text{H}^+$ ) als Hydrotrifluoracetat.

## 1-(4-Fluor-phenyl)-piperidin-4-carbonsäure

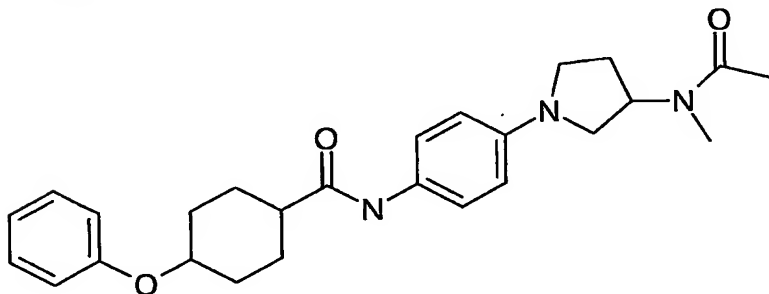
- In einem ausgeheizten und mit Argon gespülten Kolben wurden 0,875 g 4-Bromfluorbenzol, 0,016 g  $\text{Pd}(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$ , 0,022 g 2-(Dicyclohexylphosphino)biphenyl und 2,28 g Cäsiumcarbonat gegeben und mit
- 15 0,943 g 4-Piperidincarbonsäureethylester in 5 mL entgastem Toluol versetzt. Die Lösung wurde über Nacht auf 100 °C erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde die Mischung im Vakuum eingeeengt. Der Rückstand wurde in Ethylacetat/ Wasser
- 20 aufgenommen. Die organische Phase wurde mit 10%  $\text{NaHCO}_3$ -Lsg. gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum eingeeengt. Der Rückstand wurde durch präparative HPLC gereinigt.
- Zu einer Lösung aus 1,1 g 1-(4-Fluor-phenyl)-piperidin-4-carbonsäureethylester in 100 mL Methanol wurden 4,4 mL einer 2N Kaliumhydroxidlösung gegeben. Es
- 25 wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurde mit 5%

APD62429PC

Salzsäure ein pH-Wert von 6 eingestellt und die Lösung im Vakuum eingeeengt. Der Rückstand wurde durch präparative HPLC gereinigt.

## 5 Beispiel 276

4-Phenoxy-cyclohexancarbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid



10 Eine Lösung aus 0,106 g 4-Phenoxy-cyclohexancarbonsäure und 0,113 g N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid in 9 mL DMF wurde bei 0°C mit 0,251 g PyBOP und 0,135 mL Triethylamin versetzt. Nach 10 Minuten ließ man die Lösung auf Raumtemperatur kommen und rührte über Nacht bei dieser Temperatur. Anschließend wurde das Lösungsmittel im Vakuum entfernt und der Rückstand in Wasser / Ethylacetat aufgenommen. Die Ethylacetatphase wurde mit 15 10% Zitronensäure und 10% NaHCO<sub>3</sub>-Lösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Der Rückstand wurde durch präparative HPLC gereinigt. Das gewünschte Produkt wurde erhalten. Molekulargewicht 435,25 (C<sub>26</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>), MS: 436 (M+H<sup>+</sup>).

## 20 4-Phenoxy-cyclohexancarbonsäure

Zu einer Lösung aus 0,522 g 4-Hydroxycyclohexancarbonsäureethylester in 5,0 mL Pyridin wurden 0,63 g p-Toluolsulfonylchlorid gegeben. Die Reaktion wurde 3 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Die Reaktionsmischung wurde im Vakuum eingeeengt. Der erhaltene Feststoff wurde in Wasser und Ethylacetat 25 aufgenommen und die organische Phase dreimal mit 2 N Salzsäure und einmal mit gesättigter NaCl-Lösung gewaschen. Die organische Phase wurde über

APD62429PC

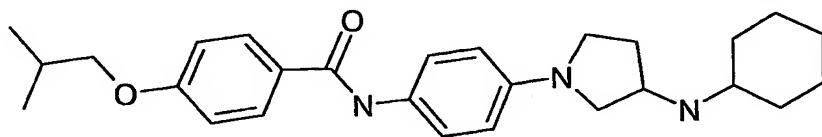
Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum eingeengt. Das erhaltene Produkt wurde ohne weitere Reinigung im nächsten Schritt eingesetzt.

Das erhaltene Produkt (0,55 g) wurde in 11,2 mL DMF gelöst, mit 0,159 g Phenol und 0,549 g Cäsiumcarbonat versetzt. Dann wurde die Lösung 6 Stunden auf 80 °C erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde die Mischung im Vakuum eingeengt und säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt (Eluent: Ethylacetat / n-Heptan 1:1). Das gewünschte Produkt wurde erhalten. Molekulargewicht 248,32 (C<sub>15</sub>H<sub>20</sub>O<sub>3</sub>), MS: 249 (M+H<sup>+</sup>).

Zu einer Lösung aus 0,12 g 4-Phenoxy-cyclohexancarbonsäureethylester in 8 mL WASSER/THF (1:1) wurden 0,06 mL 2 N Kaliumhydroxidlösung gegeben. Die Lösung wurde 3 Stunden auf 60 °C erwärmt. Der Ansatz wurde mit Ethylacetat und 10% Zitronensäure versetzt. Die wässrige Phase wurde dreimal mit Ethylacetat extrahiert, über Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum eingeengt. Die erhaltene Verbindung wurde ohne weitere Reinigung in die nächste Stufe eingesetzt.

#### Beispiel 277

N-[4-(3-Cyclohexylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-isobutoxy-benzamid



#### Methode N

(4-Isobutoxy-N-[4-(3-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid (50 mg) in Methanol (2 mL) wurde mit Aminocyclohexan (28 mg) und Eisessig (10 mg) versetzt und eine Lösung von Natriumcyanoborhydrid (1M in Toluol; 0,17 mL) zugegeben. Nach 8 Stunden wurde die Reaktionslösung eingeengt und zwischen Ethylacetat und Wasser verteilt. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeengt. Das Rohprodukt wurde durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 435,61 (C<sub>27</sub>H<sub>37</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 436 (M+H<sup>+</sup>).



APD62429PC

#### 4-Isobutoxy-N-[4-(3-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid

Nach Methode E-a wurde 4-Isobutoxybenzoesäure mit 4-(1,4-Dioxa-7-aza-spiro[4.4]non-7-yl)-phenylamin umgesetzt. Das erhaltene Amid (0,25 g) in Aceton (10 mL) wurde mit para-Toluolsulfonsäure (Monohydrat, 109 mg) versetzt und die  
5 Mischung für 8 Stunden am Rückfluss gekocht. Nach Zusatz von Triethylamin (0,5 mL) wurde die Mischung mit Wasser verdünnt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 352,44 (C<sub>21</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 353 (M+H<sup>+</sup>).

10 Auf analoge Weise wurde unter Verwendung von 4-Butoxybenzoesäure 4-Butoxy-N-[4-(3-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid erhalten. Ebenso wurde aus 4-Butoxybenzoesäure und 4-(1,4-Dioxa-7-aza-spiro[4.4]non-7-yl)-3-fluor-phenylamin zunächst 4-Butoxy-N-[4-(1,4-dioxa-7-aza-spiro[4.4]non-7-yl)-3-fluor-phenyl]-benzamid erhalten, das nach Methylierung nach Methode F und Behandeln mit  
15 para-Toluolsulfonsäure, wie oben beschrieben, 4-Butoxy-N-[3-fluor-4-(3-oxo-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid ergab.

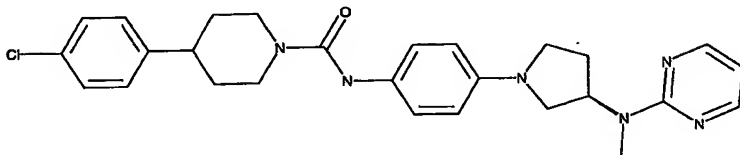
#### 4-(1,4-Dioxa-7-aza-spiro[4.4]non-7-yl)-phenylamin

Eine Lösung von 1-Benzyl-3-pyrrolidinon (5.0 g) in Dichlormethan (30 mL) und  
20 Etyhlenglykol (2,67 g) wurde langsam mit Trimethylchlorsilan (9.3 g) versetzt. Nach 18 Stunden wurde das Gemisch in Natronlauge (1N) gegossen. Die organische Phase wurde abgetrennt, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde in Methanol (30 mL) gelöst und Ammoniumformiat (5.2 g) sowie Palladiumhydroxid (10% auf Kohle, 300 mg) zugegeben. Die  
25 Mischung wurde für 8 Stunden am Rückfluss gekocht, filtriert und eingeeengt. Der Rückstand wurde nach Methode C mit 4-Fluornitrobenzol umgesetzt. Schliesslich wurde nach Methode B hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 220,27 (C<sub>12</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 221 (M+H<sup>+</sup>). Analog wurde 4-(1,4-Dioxa-7-aza-spiro[4.4]non-7-yl)-3-fluor-phenylamin unter  
30 Verwendung von 3,4-Difluornitrobenzol erhalten.

APD62429PC

## Beispiel 278

(R)-4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure {4-[3-(methyl-pyrimidin-2-yl-  
5 amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid

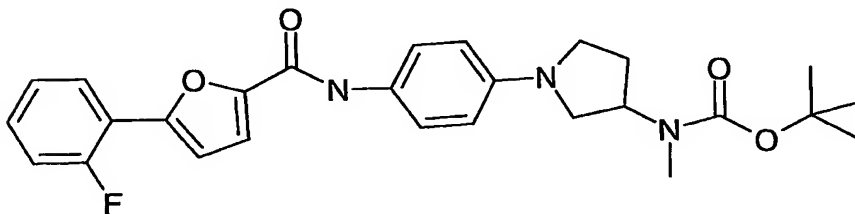


(R)-4-(4-Chlor-phenyl)-piperidin-1-carbonsäure [4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-  
phenyl]-amid (100 mg) wurde in N-Methylpyrrolidon (3 mL) mit Kaliumcarbonat  
(100 mg) und 2-Brompyrimidin (50 mg) für 4 Stunden bei 100°C umgesetzt. Dann  
10 wurde die Reaktionslösung zwischen Ethylacetat und Wasser verteilt. Die  
organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das  
Rohprodukt wurde durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt  
mit dem Molekulargewicht 491,04 (C<sub>27</sub>H<sub>31</sub>ClN<sub>6</sub>O); MS (ESI): 491 (M+H<sup>+</sup>).

15

## Beispiel 279

[1-(4-[[5-(2-Fluor-phenyl)-furan-2-carbonyl]-amino]-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-  
carbaminsäure-tert-butylester



20

## Methode O

In einem 10 mL Zwei-Hals-Kolben wurde zu einer Lösung aus (1-{4-[(5-Brom-  
furan-2-carbonyl)-amino]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäure tert-  
butylester (252 mg) in entgastem Toluol (4 mL) unter Argon

APD62429PC

- Tetrakis(triphenylphosphin)palladium(0) (20 mg) gegeben und 10 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurde mit einer Lösung von 2-Fluorbenzolboronsäure (73 mg in 1 mL Ethanol) und 0,35 mL 2M Natriumcarbonatlösung versetzt und der Ansatz 24 Stunden bei 100 °C gerührt.
- 5    Danach wurde das Reaktionsgemisch mit Wasser (5 mL) und Ethylacetat (5ml) versetzt, die organische Phase abgetrennt und die wässrige Phase 2x mit Ethylacetat (10 mL) extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden eingeeengt und der Rückstand durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt das gewünschte Produkt mit dem Molekulargewicht 479,56 (C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub>); MS
- 10    (ESI): 480 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat. Alternativ kann als Base Cäsiumcarbonat verwendet und die Reaktion in einer Mikrowellenapparatur für 3 Minuten auf 150°C erwärmt werden.

- (1-{4-[(5-Brom-furan-2-carbonyl)-amino]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäure-tert-butylester
- 15    Nach Methode E wurde 5-Brom-furan-2-carbonsäure mit [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 464,36 (C<sub>21</sub>H<sub>26</sub>BrN<sub>3</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 464 (M+H<sup>+</sup>).

- 20    Analog wurden folgende Verbindungen hergestellt:

5-Brom-furan-2-carbonsäure-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid

(1-{4-[(5-Brom-thiophen-2-carbonyl)-amino]-phenyl}-pyrrolidin-3-yl)-methyl-carbaminsäure-tert-butylester

2-Brom-thiazol-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid

- 25    4-Iod-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid

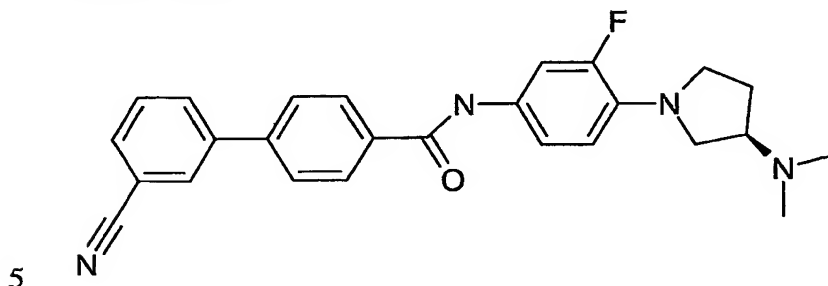
(R)-N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-3-fluor-phenyl]-4-iod-benzamid

4-Brom-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-3-fluor-benzamid

APD62429PC

## Beispiel 280

(3R)-3'-Cyano-biphenyl-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-3-fluor-phenyl]-amid



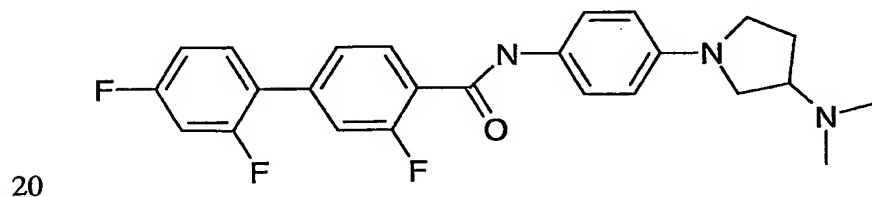
## Methode O-b

Zu einer Lösung aus 0,022 g (R)-N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-3-fluor-phenyl]-4-iod-benzamid in 0,45 mL entgastem DMF wurden 0,002 mg Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub> gegeben und 10 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurde die Lösung mit 0,035 mL Wasser, 0,021 g K<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> und 0,008 g 3-Cyanophenylboronsäure versetzt. Die Reaktionslösung wurde über Nacht auf 80 °C erhitzt. Danach wurde die Lösung abfiltriert und durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 428,20 (C<sub>26</sub>H<sub>25</sub>FIN<sub>4</sub>O); MS (ESI): 429 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

15

## Beispiel 281

3,2',4'-Trifluor-biphenyl-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



Nach Methode O-b wurde 1-Brom-2,4-difluorbenzol mit N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-2-fluor-4-boronsäure-benzamid umgesetzt. Man erhielt so

APD62429PC

das Produkt mit dem Molekulargewicht 439,19 (C<sub>25</sub>H<sub>24</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O); MS (ESI): 440 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat

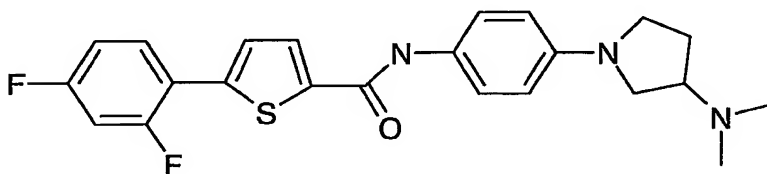
N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-2-fluor-4-boronsäure-benzamid

- 5 Nach Methode E-b wurde 4-Carboxy-3-fluorphenylboronsäure mit [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 371,18 (C<sub>19</sub>H<sub>23</sub>BFN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 372 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

10

Beispiel 282

5-(2,4-Difluor-phenyl)-thiophen-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



- 15 Nach Methode O-b wurde 1-Brom-2,4-difluorbenzol mit 2-Boronsäure-thiophen-5-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 427,52 (C<sub>23</sub>H<sub>23</sub>F<sub>2</sub>N<sub>3</sub>OS); MS (ESI): 428 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

- 20 2-Boronsäure-thiophen-5-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid

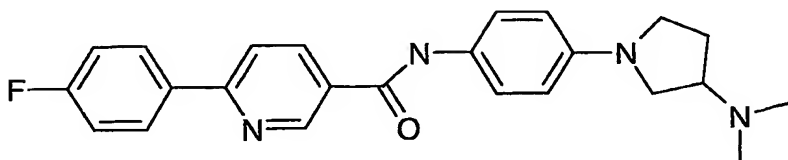
Nach Methode E-b wurde 5-Carboxy-2-thiophenboronsäure mit [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 359,15 (C<sub>17</sub>H<sub>22</sub>BN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>S); MS (ESI): 360 (M+H<sup>+</sup>) als

- 25 Hydrotrifluoracetat.

APD62429PC

## Beispiel 283

N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-6-(4-fluor-phenyl)-nicotinamid



- 5 [Trifluor-methansulfonsäure 5-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenylcarbamoyl]-pyridin-2-yl ester wurde mit 4-Fluorbenzolboronsäure unter den Bedingungen von Methode O-b umgesetzt. (Erhitzt wurde 15 Minuten in einer Mikrowellenapparatur bei 140 °C). Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 404,20 (C<sub>24</sub>H<sub>25</sub>FN<sub>4</sub>O); MS (ESI): 405 (M+H<sup>+</sup>) als
- 10 Hydrotrifluoracetat.

[Trifluor-methansulfonsäure 5-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenylcarbamoyl]-pyridin-2-yl ester

- Eine Lösung aus 0,084 mL LDA-Lösung (2M) in 0,4 mL DME wurde bei 0°C mit
- 15 einer Suspension aus 0,05 g N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-6-hydroxy-nicotinamid in 0,4 mL DME versetzt. Es wurde 2 Stunden bei 0°C nachgerührt. Anschließend versetzte man die Mischung mit einer Lösung aus 0,055 g N-Phenyltrifluormethansulfonimid in 0,2 mL DME. Man ließ die Reaktionslösung auf Raumtemperatur kommen und erhitze 3 Stunden auf 80 °C.
- 20 Nach dem Abkühlen wurde die Lösung im Vakuum eingeeengt. Der Rückstand wurde in Ethylacetat /Wasser aufgenommen und die wässrige Phase dreimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet, im Vakuum eingeeengt und durch präparative HPLC gereinigt.

25

N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-6-hydroxy-nicotinamid

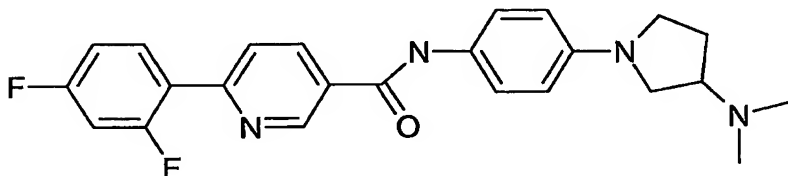
Nach Methode E-b wurde 6-Hydroxynicotinsäure mit [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem

APD62429PC

Molekulargewicht 326,17 (C<sub>18</sub>H<sub>22</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 327 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

5 Beispiel 284

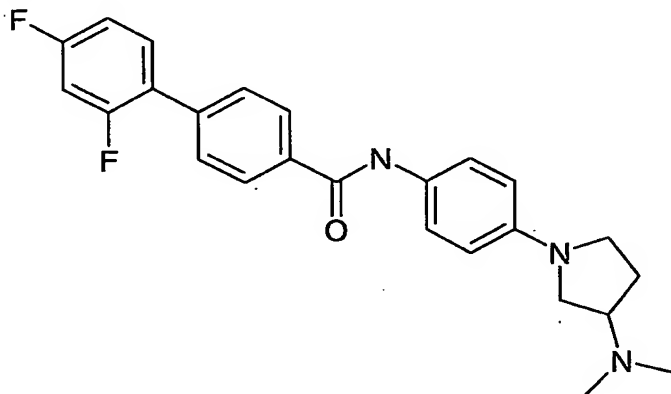
N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-6-(2,4-difluor-phenyl)-nicotinamid



- 10 Nach Methode O-b wurde 2,4-Difluorphenylboronsäure mit [Trifluor-methansulfonsäure 5-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenylcarbamoyl]-pyridin-2-yl ester umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 422,00 (C<sub>24</sub>H<sub>24</sub>F<sub>2</sub>N<sub>4</sub>O); MS (ESI): 423 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

15 Beispiel 285

2',4'-Difluor-biphenyl-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



- 20 Nach Methode E-a wurde 2',4'-Difluor-biphenyl-4-carbonsäure mit [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit

APD62429PC

dem Molekulargewicht 421,20 (C<sub>25</sub>H<sub>25</sub>F<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O); MS (ESI): 422 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat

2',4'-Difluor-biphenyl-4-carbonsäure

5 Methode P

Zu einer Lösung aus 0,051 g 2',4'-Difluor-biphenyl-4-carbonsäureethylester in 1 mL THF/WASSER (1:1) wurden 0,098 mL 1 N Lithiumhydroxidlösung gegeben, es wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Mit 5 % Salzsäure wurde die Lösung neutral gestellt, im Vakuum eingeeengt und der Rückstand über präparative

10 HPLC gereinigt.

2',4'-Difluor-biphenyl-4-carbonsäureethylester

Zu einer Lösung aus 0,091 g 4-Iodbenzoesäureethylester in 0,96 mL entgastem Toluol wurden 0,009 g Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub> gegeben und 10 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Dann wurde die Reaktionslösung mit einer Lösung aus 0,047 g 2,4-Difluorphenylboronsäure in 0,114 mL Ethanol und 0,201 mL einer 2N Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>-Lösung versetzt. Die Lösung wurde über Nacht auf 100 °C erhitzt. Anschließend wurde das Reaktionsgemisch im Vakuum eingeeengt und der Rückstand mit Wasser / Ethylacetat versetzt. Die wässrige Phase wurde dreimal mit Ethylacetat

15 extrahiert, über Natriumsulfat getrocknet, das Lösungsmittel im Vakuum entfernt und über präparative HPLC gereinigt.

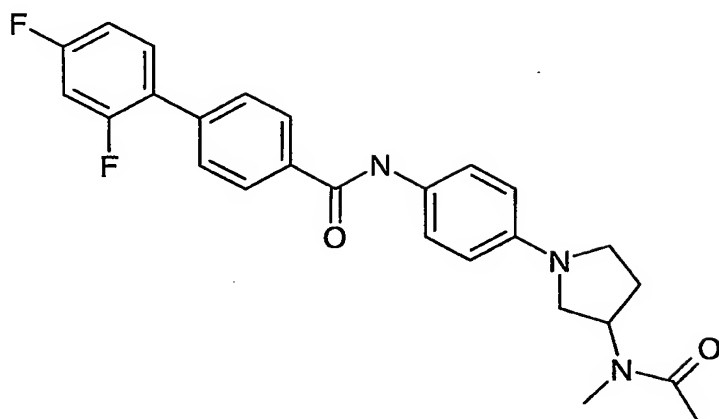
20

Beispiel 286

25 2',4'-Difluor-biphenyl-4-carbonsäure {4-[3-(acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl}-amid



APD62429PC



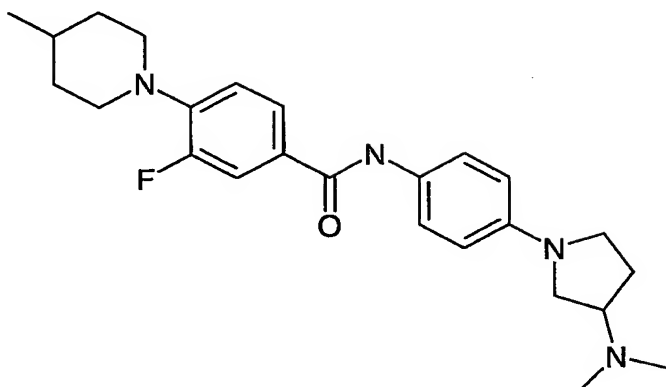
#### Methode E-b

Eine Lösung aus 0,047 g 2',4'-Difluor-biphenyl-4-carbonsäure und 0,058 g N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid in 2 mL DMF wurde bei 0°C mit  
5 0,095 g HATU, 0,068 g HOBt und 0,035 mL Triethylamin versetzt. Nach 10 Minuten ließ man die Lösung auf Raumtemperatur kommen und rührte über Nacht bei dieser Temperatur. Anschließend wurde das Lösungsmittel im Vakuum entfernt und der Rückstand in Wasser / Ethylacetat aufgenommen. Die Ethylacetatphase wurde mit 10% NaHCO<sub>3</sub>-Lösung und Wasser gewaschen. Die Ethylacetatphase  
10 wurde über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Der Rückstand wurde durch präparative HPLC gereinigt. Das gewünschte Produkt wurde erhalten. Molekulargewicht 449,19 (C<sub>26</sub>H<sub>25</sub>F<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>), MS: 450 (M+H<sup>+</sup>).

#### 15 Beispiel 287

N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-3-fluor-4-(4-methyl-piperidin-1-yl)-benzamid

APD62429PC



Nach Methode E-a wurde 3-Fluor-4-(4-methyl-piperidin-1-yl)-benzoesäure mit [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 424,00 (C<sub>25</sub>H<sub>33</sub>FN<sub>4</sub>O); MS (ESI): 425 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

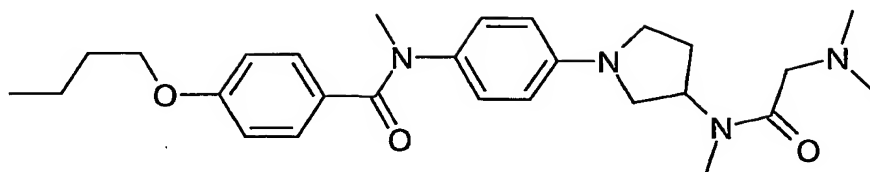
3-Fluor-4-(4-methyl-piperidin-1-yl)-benzoesäure  
3-Fluor-4-(4-methyl-piperidin-1-yl)-benzoesäuremethylester wurde nach Methode P mit Lithiumhydroxid behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 237,28 (C<sub>13</sub>H<sub>16</sub>FNO<sub>2</sub>); MS (ESI): 238 (M+H<sup>+</sup>).

3-Fluor-4-(4-methyl-piperidin-1-yl)-benzoesäuremethylester  
Zu einer Lösung aus 0,086 g 3,4-Difluorbenzoesäuremethylester und 0,050 g 4-Methylpiperidin in 0,5 mL DMF wurden 0,076 g Kaliumcarbonat gegeben. Die Reaktion wurde 2 Tage auf 60 °C erwärmt, abfiltriert und durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 251,3 (C<sub>14</sub>H<sub>18</sub>FNO<sub>2</sub>); MS (ESI): 252 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

Beispiel 288

4-Butoxy-N-(4-{3-[(2-dimethylamino-acetyl)-methyl-amino]-pyrrolidin-1-yl}-phenyl)-N-methyl-benzamid

APD62429PC

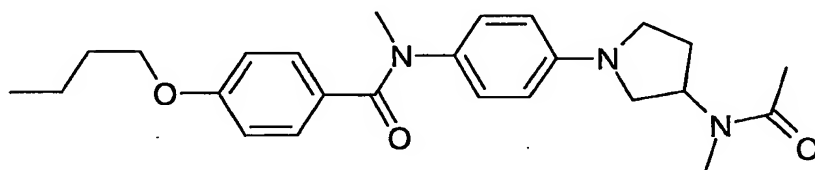


Nach Methode E wurde 4-Butoxy-N-methyl-N-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid mit N,N-Dimethylglycin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 466,63 (C<sub>27</sub>H<sub>38</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 467 (M+H<sup>+</sup>).

- 5 Analog wurde (R)-4-Butoxy-N-(4-{3-[(2-dimethylamino-acetyl)-methyl-amino]-pyrrolidin-1-yl}-phenyl)-N-methyl-benzamid erhalten.

#### Beispiel 289

- 10 N-[4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl]-4-butoxy-N-methyl-benzamid



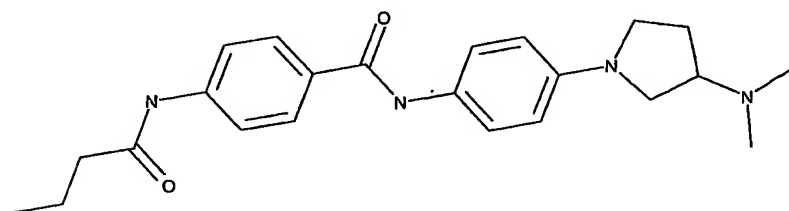
4-Butoxy-N-methyl-N-[4-(3-methylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid wurde mit Pyridin und Acetanhydrid versetzt. Flüchtige Anteile wurden nach 2 Stunden entfernt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 423,56

- 15 (C<sub>25</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 424 (M+H<sup>+</sup>).

#### Beispiel 290

4-Butyrylamino-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid

20



APD62429PC

## Methode Q

- 4-Amino-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid (32 mg) in Dichlormethan (2 mL) wurde mit Kaliumcarbonat (50 mg) und Butyrylchlorid (11 mg) versetzt. Die Mischung wurde nach 12 Stunden filtriert und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 394,52 (C<sub>23</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 395 (M+H<sup>+</sup>).
- Alternativ kann man nach Methode E 4-Amino-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid mit Buttersäure umsetzen.

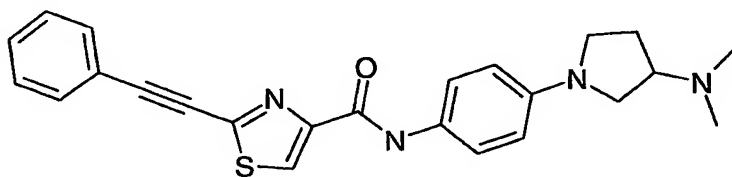
## 10 4-Amino-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid

Nach Methode E wurde 4-tert-Butoxycarbonylamino-benzoesäure mit [1-(4-Aminophenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethylamin umgesetzt und das Produkt nach Methode G behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 324,43 (C<sub>19</sub>H<sub>24</sub>N<sub>4</sub>O); MS (ESI): 325 (M+H<sup>+</sup>).

15

## Beispiel 291

2-Phenylethynyl-thiazol-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



20

- 2-Brom-thiazol-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid (100 mg) wurde in Tetrahydrofuran (2 mL) gelöst und mit Phenylacetylen (52 mg), Triethylamin (52 mg), Triphenylphosphin (17 mg), Bis(triphenylphosphin)palladiumdichlorid (89 mg) und Kupfer(I)-iodid (9,6 mg) versetzt. Die Reaktion wurde für 3 Minuten in einer Mikrowellenapparatur auf 150°C erhitzt und anschließend eingeeengt. Der Rückstand wurde durch

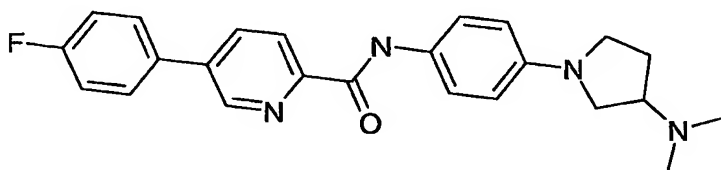
25

APD62429PC

präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 416,55 (C<sub>24</sub>H<sub>24</sub>N<sub>4</sub>O<sub>5</sub>); MS (ESI): 417 (M+H<sup>+</sup>).

5 Beispiel 292

5-(4-Fluor-phenyl)-pyridin-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



Methode O-a

- 10 5-Chlor-pyridin-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid (100 mg) gelöst in Toluol wurde mit 4-Fluorphenylboronsäure (81 mg), POPD (15 mg) und Cäsiumcarbonat (2M aq.; 0.5 mL) versetzt. Die Reaktion wurde für 10 Minuten in einer Mikrowellenapparatur auf 150°C erhitzt und anschließend eingeeengt. Der Rückstand wurde durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt
- 15 so das Produkt mit dem Molekulargewicht 404,49 (C<sub>24</sub>H<sub>25</sub>FN<sub>4</sub>O); MS (ESI): 405 (M+H<sup>+</sup>).

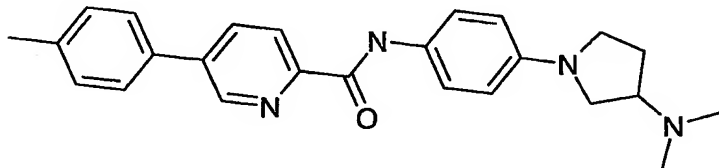
5-Chlor-pyridin-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid

- [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin wurde nach Methode E mit 5-chlor-pyridin-2-carbonsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem
- 20 Molekulargewicht 344,85 (C<sub>18</sub>H<sub>21</sub>ClN<sub>4</sub>O); MS (ESI): 345 (M+H<sup>+</sup>).

Beispiel 293

APD62429PC

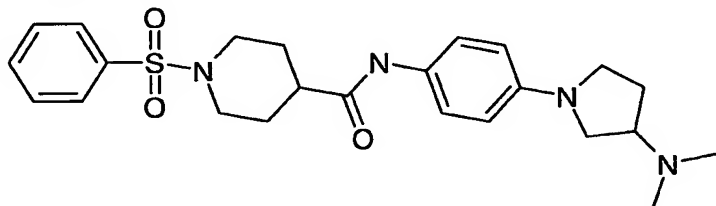
5-(4-Fluor-phenyl)-pyridin-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



- 5 Nach Methode O-a wurde 5-Chlor-pyridin-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid mit 4-Methylphenylboronsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 400,53 (C<sub>25</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O); MS (ESI): 401 (M+H<sup>+</sup>).

#### 10 Beispiel 294

1-Benzolsulfonyl-piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



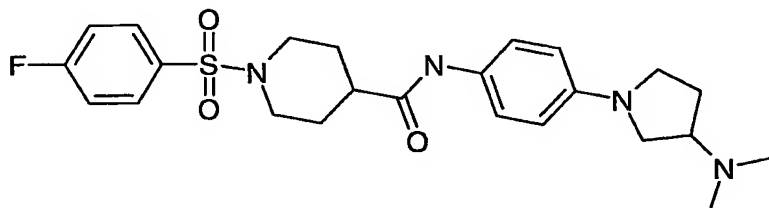
- 15 Piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid (70 mg) gelöst in N-Methylpyrrolidon (2 mL) wurde versetzt mit Kaliumcarbonat (45 mg) und Benzolsulfonyl chlorid (35 mg). Nach 12 Stunden wurde die Mischung filtriert und das Filtrat durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 456,61 (C<sub>24</sub>H<sub>32</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>S); MS (ESI): 457 (M+H<sup>+</sup>).

20

#### Beispiel 295

APD62429PC

1-(4-Fluor-benzolsulfonyl)-piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid

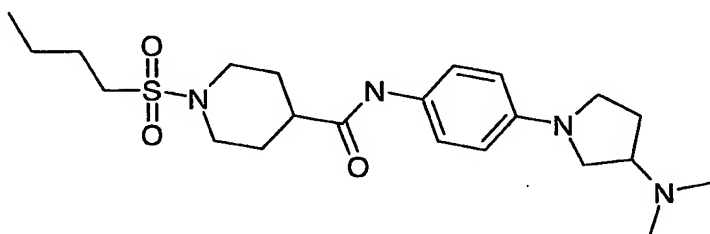


- 5 Piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid (70 mg) gelöst in N-Methylpyrrolidon (2 mL) wurde versetzt mit Kaliumcarbonat (45 mg) und 4-Fluor-benzolsulfonyl chlorid (40 mg). Nach 12 Stunden wurde die Mischung filtriert und das Filtrat durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 474,60 (C<sub>24</sub>H<sub>31</sub>FN<sub>4</sub>O<sub>3</sub>S); MS (ESI): 475 (M+H<sup>+</sup>).

10

#### Beispiel 296

1-(Butane-1-sulfonyl)-piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



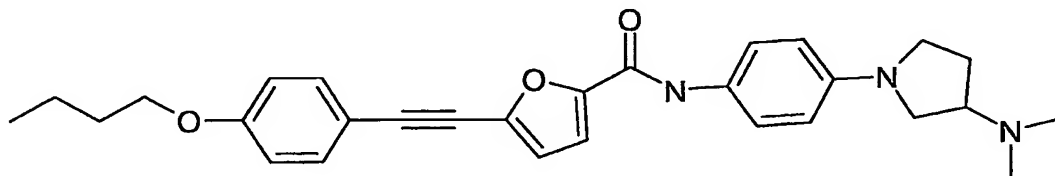
- 15 Piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid (70 mg) gelöst in N-Methylpyrrolidon (2 mL) wurde versetzt mit Kaliumcarbonat (45 mg) und Butylsulfonylchlorid (30 mg). Nach 12 Stunden wurde die Mischung filtriert und das Filtrat durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 436,62 (C<sub>22</sub>H<sub>36</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>S); MS (ESI): 437 (M+H<sup>+</sup>).

20

APD62429PC

## Beispiel 297

5-(4-Butoxy-phenylethynyl)-furan-2-carbonsäure-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



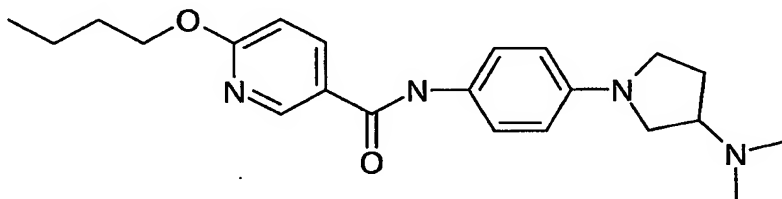
## 5 Methode J-a

5-Brom-furan-2-carbonsäure-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid (75 mg) wurde zusammen mit 1-Butoxy-4-ethinyl-benzol (35 mg) in N,N-Dimethylformamid (1 mL) gelöst und unter Argon zu einer Suspension von Pd(tBu3P)2Cl2 (4 mg), Kupfer(I)-iodid (75 mg) und N,N-Diisopropylamin (20 mg) in Wasserfreiem Tetrahydrofuran (3 mL) getropft. Der Ansatz wird 8 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Zur Aufarbeitung wurde die Reaktion über einen Spritzenfilter filtriert, eingengt und das Rohprodukt über präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 471,6 (C29H33N3O3); MS (ESI): 472 (M+H+) als Hydrotrifluoracetat.

15

## Beispiel 298

6-Butoxy-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-nicotinamid



## 20 Methode H-a

Eine Lösung aus 0,1 g Kaliumhydroxid in 1 mL DMSO wurde 10 Minuten bei Raumtemperatur gerührt und anschließend mit 0,1 g N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-6-hydroxy-nicotinamid versetzt. Die Reaktionslösung wurde 10 Minuten gerührt und anschließend mit 0,084 g 1-Brombutan versetzt. Es wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Nach Zugabe von Wasser und

25

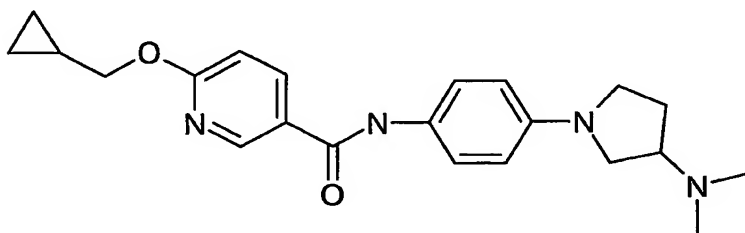


APD62429PC

- Ethylacetat, wurde die wässrige Phase dreimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet, im Vakuum eingengt und durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 382,24 (C<sub>22</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 383 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

## Beispiel 299

6-Cyclopropylmethoxy-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-nicotinamid



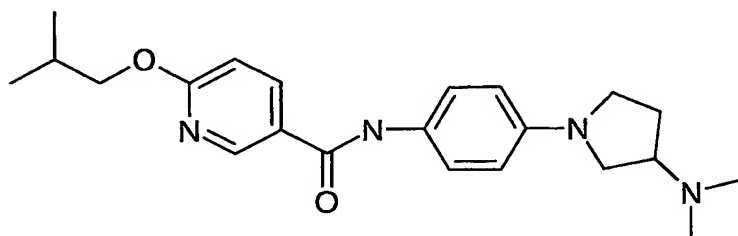
10

Nach Methode H-a wurde (Brommethyl)cyclopropan mit N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-6-hydroxy-nicotinamid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 380,22 (C<sub>22</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 381 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

15

## Beispiel 300

N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-6-isobutoxy-nicotinamid

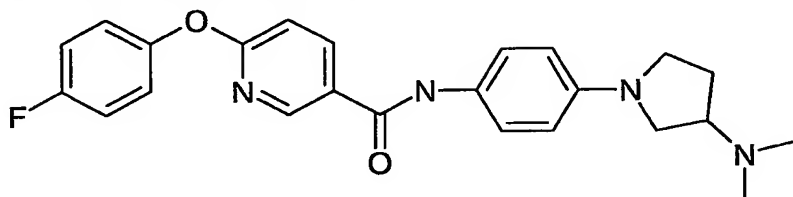


- Nach Methode H-a wurde 1-Brom-2-methylpropan mit N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-6-hydroxy-nicotinamid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 382,24 (C<sub>22</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 383 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

APD62429PC

## Beispiel 301

N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-6-(4-fluor-phenoxy)-nicotinamid



5

Zu einer Lösung aus 0,041 g 6-Chlor-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-nicotinamid und 4-Fluorphenol (30 mg) in 0,8 mL DMF wurden 49 mg Kaliumcarbonat gegeben und die Reaktion 90 Minuten bei 140 °C in einer Mikrowellenapparatur erwärmt. Nach Zugabe von Wasser und Ethylacetat wurde die wässrige Phase dreimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet, im Vakuum eingeeengt und durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 420,2 (C<sub>24</sub>H<sub>25</sub>FN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 421 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

10

15

6-Chlor-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-nicotinamid

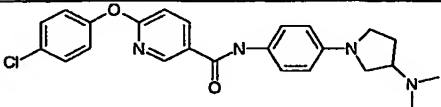
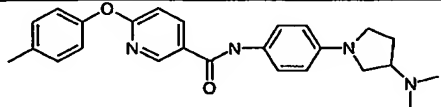
Nach Methode E-b wurde 6-Chlornicotinsäure mit [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 344,14 (C<sub>18</sub>H<sub>21</sub>N<sub>4</sub>O); MS (ESI): 345 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

20

Die folgenden Beispiele wurden analog dargestellt.

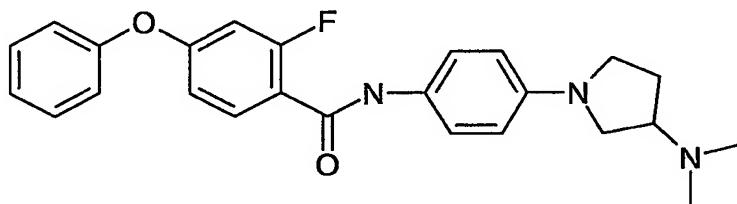
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Molekulargewicht	M+H <sup>+</sup>
302		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	402,21	403

APD62429PC

303		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	436,17	437
304		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	416,22	417

## Beispiel 305

N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-2-fluor-4-phenoxy-benzamid



5

Zu einer Lösung aus 0,008 g Phenol in 0,5 mL Methylenchlorid wurde gepulvertes Molekularsieb (4 A), 0,01 g Kupferacetat und 0,02 g N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-2-fluor-4-boronsäure-benzamid gegeben und 24 Stunden bei 40 °C gerührt. Anschließend wurde das Lösungsmittel im Vakuum entfernt, der Rückstand in Wasser / Ethylacetat aufgenommen und die wässrige Phase dreimal mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Natriumsulfat getrocknet, im Vakuum eingeeengt und durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 419,2 (C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 420 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

15

N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-2-fluor-4-boronsäure-benzamid

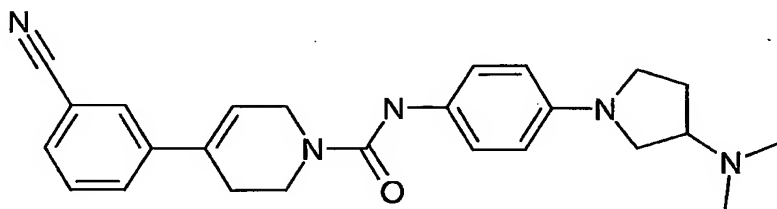
Nach Methode E-b wurde 4-Carboxy-3-fluorphenylboronsäure mit [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 371,18 (C<sub>19</sub>H<sub>23</sub>BFN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 372 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

20

APD62429PC

## Beispiel 306

4-(3-Cyano-phenyl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-  
5 pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid

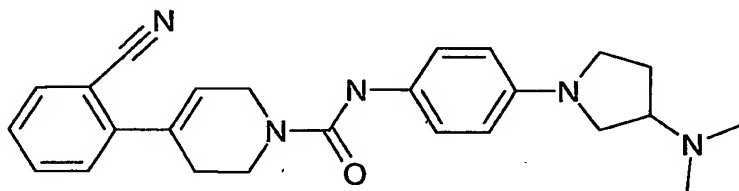


4-(4,4,5,5-Tetramethyl-[1,3,2]dioxaborolan-2-yl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-  
carboxylic acid [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid wurde nach  
Methode O-a mit 3-Brombenzonitril umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit  
10 dem Molekulargewicht 415,54 (C<sub>25</sub>H<sub>29</sub>N<sub>5</sub>O); MS (ESI): 416 (M+H<sup>+</sup>)

4-(4,4,5,5-Tetramethyl-[1,3,2]dioxaborolan-2-yl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-  
carboxylic acid [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid  
Nach Methode A wurde 4-(4,4,5,5-Tetramethyl-[1,3,2]dioxaborolan-2-yl)-1,2,3,6-  
15 tetrahydro-pyridin mit [1-(4-amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin  
umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 440,40  
(C<sub>24</sub>H<sub>37</sub>BN<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 441 (M+H<sup>+</sup>)

## 20 Beispiel 307

4-(2-Cyano-phenyl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-  
pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



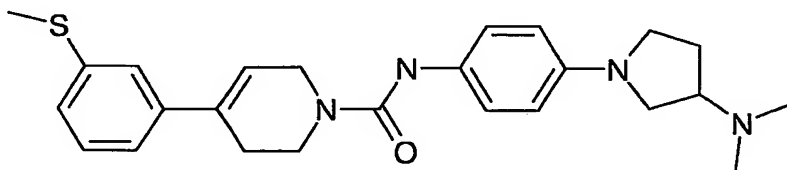
4-(4,4,5,5-Tetramethyl-[1,3,2]dioxaborolan-2-yl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-  
25 carboxylic acid [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid wurde nach

APD62429PC

Methode O-a mit 2-Brombenzonitril umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 415,54 (C<sub>25</sub>H<sub>29</sub>N<sub>5</sub>O); MS (ESI): 416 (M+H<sup>+</sup>)

5 Beispiel 308

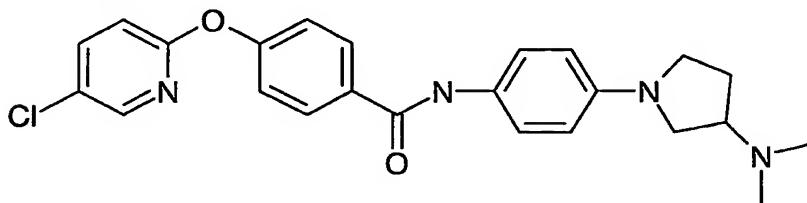
4-(3-Methylsulfanyl-phenyl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



- 10 4-(4,4,5,5-Tetramethyl-[1,3,2]dioxaborolan-2-yl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carboxylic acid [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid wurde nach Methode O-a mit 3-Bromthioanisol umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 436,62 (C<sub>25</sub>H<sub>32</sub>N<sub>4</sub>OS); MS (ESI): 437 (M+H<sup>+</sup>)

15 Beispiel 309

4-(5-Chlor-pyridin-2-yloxy)-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid



- 20 Zu einer Lösung aus 0,19 g Essigsäure 4-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenylcarbamoyl]-phenylester in 2 mL DMF wurden 0,143 g Kaliumcarbonat gegeben und die Lösung 15 Minuten bei 130 °C in einer Mikrowellenapparatur erhitzt. Anschließend wurde die Lösung mit Wasser und Ethylacetat versetzt, die Wasserphase gefriergetrocknet und der Rückstand ohne weitere Aufreinigung in der nächsten Stufe eingesetzt.

25

Methode R

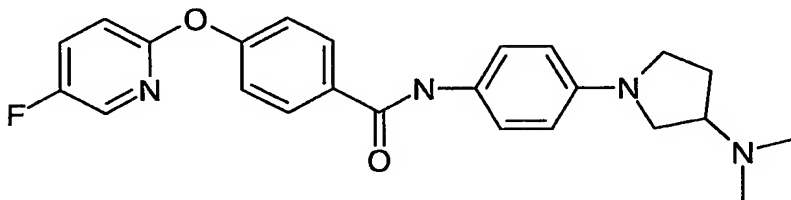
APD62429PC

Eine Lösung aus 0,05 g N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-hydroxy-benzamid, 0,017 g 2,5-Dichlorpyridin, 0,064 g Kaliumcarbonat in 0,8 mL DMF wurde 30 Minuten auf 230 °C in einer Mikrowellenapparatur erwärmt. Die Lösung wurde abfiltriert und durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 436,17 (C<sub>24</sub>H<sub>25</sub>ClN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 437 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

Essigsäure 4-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenylcarbonyl]-phenylester  
Nach Methode E-b wurde 4-Acetoxybenzoesäure mit [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 367,19 (C<sub>21</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 368 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

#### 15 Beispiel 310

N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-(5-fluor-pyridin-2-yloxy)-benzamid

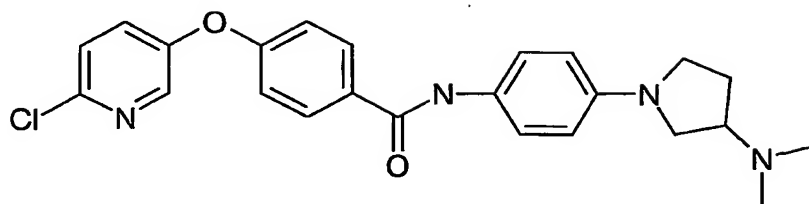


Nach Methode R wurde 2-Chlor-5-fluorpyridin mit N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-4-hydroxy-benzamid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 420,2 (C<sub>24</sub>H<sub>25</sub>FN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 421 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

#### Beispiel 311

25 4-(6-Chlor-pyridin-3-yloxy)-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-benzamid

APD62429PC

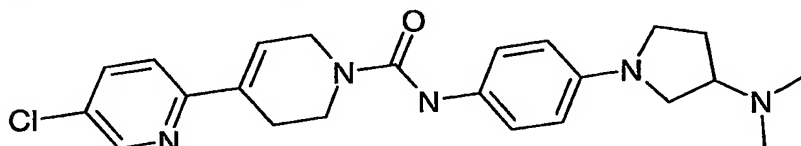


Wurde als Nebenprodukt der Umsetzung im Beispiel 310 erhalten. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 436,95 (C<sub>24</sub>H<sub>25</sub>ClN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 437 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

5

### Beispiel 312

5-Chlor-3',6'-dihydro-2'H-[2,4']bipyridinyl-1'-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid



10

[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin (32 mg) und Carbonyldiimidazol (27,1 mg) wurden in Acetonitril (1,5 mL) gelöst und die Mischung für 3 Stunden gerührt. Zu einer Lösung von 5-Chlor-1',2',3',6'- tetrahydro-[2,4']bipyridin (40,7 mg) in THF (1 mL) und Chloroform (0,5 mL) wurde Triethylamin (63,4 µL) gegeben.

15 Nach 15 Minuten wurde die Mischung zur ersten Lösung getropft und über Nacht gerührt. Die Mischung wurde eingeeengt und der Rückstand zwischen

Dichlormethan und Wasser verteilt. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Um Verunreinigungen durch das primäre und / oder sekundäre Amin zu entfernen wurde der Rückstand in

20 Dichlormethan (1,5 mL) gelöst und die Lösung zu einer gerührten Suspension von polymergebundem p-Toluolsulfonsäurechlorid (0,5 g) in Dichlormethan (6 mL) und Triethylamin (128 µL) gegeben. Nach 3 Stunden wurde filtriert und das Harz mehrmals mit Dichlormethan gewaschen. Die kombinierten organischen Phasen wurden eingeeengt. Der Rückstand wurde durch Chromatographie (Kieselgel, Laufmittel: Ethylacetat / Dichlormethan (5%), Ammoniak (7N in Methanol, 2%)

25 später Ethylacetat / Dichlormethan (5%), Ammoniak (7N in Methanol, 3%)

gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 425,97 (C<sub>23</sub>H<sub>28</sub>ClN<sub>5</sub>O); MS (ESI): 426 (M+H<sup>+</sup>).

#### 5-Chlor-1',2',3',6'- tetrahydro-[2,4']bipyridin

- 5 Eine Lösung von 5-Chlor-3',6'-dihydro-2'H-[2,4']bipyridin-1'-carbonsäure tert-butylester (50 mg) in Chloroform (2,4 mL) wurde mit Chlorwasserstoff (4N in Dioxan; 0,8 mL) versetzt und die Mischung nach 13 Stunden eingeeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 194,67 (C<sub>10</sub>H<sub>11</sub>ClN<sub>2</sub>); MS (ESI): 195 (M+H<sup>+</sup>).

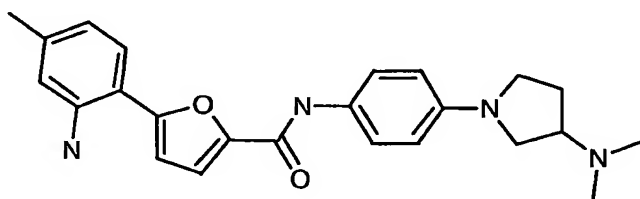
10

#### 5-Chlor-3',6'-dihydro-2'H-[2,4']bipyridin-1'-carbaminsäure tert-butylester

- Zu einem Gemisch aus 4-(4,4,5,5-Tetramethyl-[1,3,2]dioxaborolan-2-yl)-3,6-dihydro-2H-pyridin-1-carbaminsäure tert-butylester (Eastwood, Paul R., *Tetrahedron Lett*, 41, 19, 2000, 3705-3708; 200 mg), Kaliumcarbonat (0.265 g) und Pd(dppf)Cl<sub>2</sub> (50 mg) wurde eine Lösung von von 2-Brom-5-chlorpyridin (131 mg) in DMF (entgast mit Stickstoff; 4,5 mL) gegeben. Die Mischung wurde für 8 Stunden auf 80 °C erwärmt. Nach dem Abkühlen wurde die Mischung mit Dichlormethan verdünnt und mit Natriumcarbonatlösung und Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt.
- 20 Der Rückstand wurde durch Chromatographie (Kieselgel, Laufmittel: Heptan / Ethylacetat (2%) / Dichlormethan (5%) später Heptan / Ethylacetat (5%) / Dichlormethan (5%) gereinigt.

#### 25 Beispiel 313

5-(2-Amino-4-methyl-phenyl)-furan-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)- phenyl]-amid



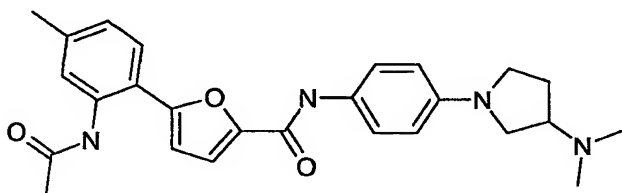


5-(2-Nitro-4-methyl-phenyl)-furan-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid wurde nach Methode B hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 404,22 (C<sub>24</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 405 (M+H<sup>+</sup>).

5

### Beispiel 314

**5-(2-Acetylamino-4-methyl-phenyl)-furan-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin- 1-yl)-phenyl]-amid**

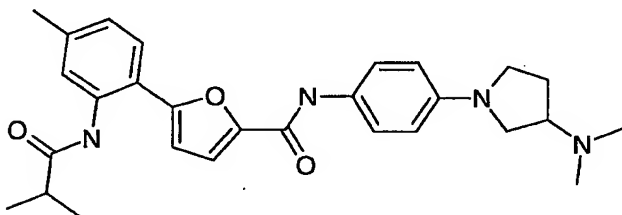


10 5-(2-Amino-4-methyl-phenyl)-furan-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)- phenyl]-amid wurde nach Methode Q mit Acetylchlorid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 446,23 (C<sub>26</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 447 (M+H<sup>+</sup>).

15

### Beispiel 315

**5-(2-Isobutyrylamino-4-methyl-phenyl)-furan-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid**



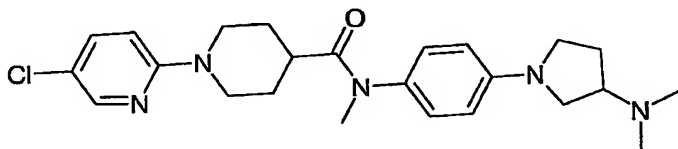
20 5-(2-Amino-4-methyl-phenyl)-furan-2-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid wurde nach Methode Q mit Isobutyrylchlorid umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 474,26 (C<sub>28</sub>H<sub>34</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 475 (M+H<sup>+</sup>).

25

APD62429PC

## Beispiel 316

5'-Chlor-3,4,5,6-tetrahydro-2H-[1,2']bipyridinyl-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-methyl-amid



- 5 Piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-methyl-amid (44,4 mg) und 2,5-Dichlorpyridin (60 mg) wurden für 15 Minuten auf 160°C erhitzt. Es wurde o-Xylen (0,5 mL) zugesetzt und für weitere 2 Stunden auf 160°C erhitzt. Das abgekühlte Rohgemisch wurde durch Chromatographie (Kieselgel, Eluent: Ethylacetat / Ammoniak (7N in Methanol)) gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 442,01 (C<sub>24</sub>H<sub>32</sub>ClN<sub>5</sub>O); MS (ESI): 442 (M+H<sup>+</sup>).
- 10

Piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-methyl-amid  
Nach Methode G wurde 4-[[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-methyl-carbamoyl]-piperidine-1-carbonsäure tert-butylester mit Trifluoressigsäure  
15 behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 330,48 (C<sub>19</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O); MS (ESI): 331 (M+H<sup>+</sup>).

Analog läßt sich Piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid herstellen.

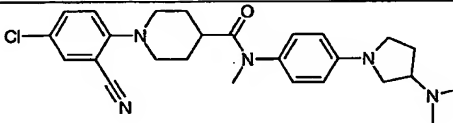
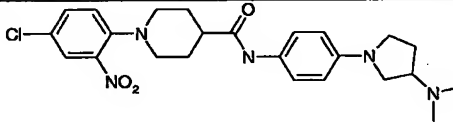
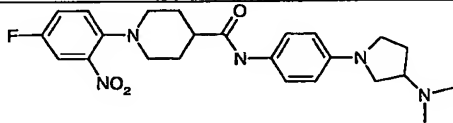
- 4-[[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-methyl-carbamoyl]-piperidine-1-carbonsäure tert-butylester  
20

Eine Lösung von N-Boc-piperidin-4-carbonsäure (550 mg) und Pyridin (0,47 mL) in Dichlormethan (15 mL) wurde mit Thionylchlorid (0,21 mL) versetzt und nach 30 Minuten eine Lösung von Dimethyl-[1-(4-methylamino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-amin (0,5 g), Triethylamin (1,17 mL), DMAP (0,44 g) und Dichlormethan (10 mL)  
25 tropfenweise zugesetzt. Nach 16 Stunden wurde die Mischung mit Dichlormethan verdünnt, mit Wasser und gesättigter Kochsalzlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch Chromatographie (Kieselgel, Eluent: Ethylacetat / Ammoniak (7N in Methanol)) gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 430,60  
30 (C<sub>24</sub>H<sub>38</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 431 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

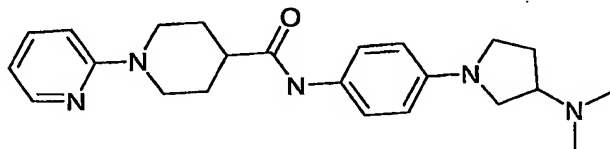
Analog lässt sich 4-[[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-carbamoyl]-piperidin-1-carbonsäure tert-butylester herstellen.

5 Die folgenden Beispiele wurden analog dargestellt.

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Molekulargewicht	M+H+
317		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> ClN <sub>5</sub> O	466,03	466
318		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> ClN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	471,99	472
319		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	455,54	456

#### Beispiel 320

- 10 3,4,5,6-Tetrahydro-2H-[1,2']bipyridinyl-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid

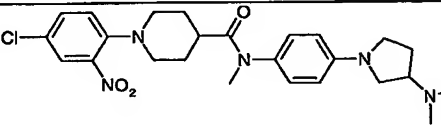
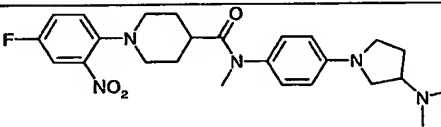


- 15 Piperidine-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid (30 mg) und 2-Chlorpyridin (90 mg) wurden für 2 Stunden auf 160°C erhitzt. Es wurde 2-Chlorpyridin (0,2 mL) zugesetzt und nochmals für 4 Stunden auf 160°C erhitzt. Das abgekühlte Rohgemisch wurde durch Chromatographie (Kieselgel, Eluent:

APD62429PC

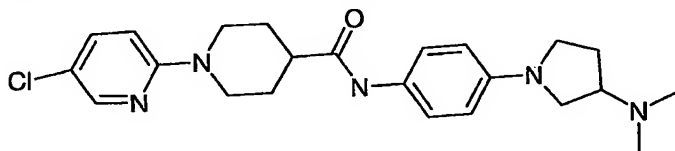
Ethylacetat / Ammoniak (3N in Methanol)) gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 393,54(C<sub>23</sub>H<sub>31</sub>N<sub>5</sub>O); MS (ESI): 394 (M+H<sup>+</sup>).

5 Die folgenden Beispiele wurden analog dargestellt.

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Molekulargewicht	M+H <sup>+</sup>
321		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> ClN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	486,02	486
322		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	469,56	470

#### Beispiel 323

- 10 5'-Chlor-3,4,5,6-tetrahydro-2H-[1,2']bipyridinyl-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid

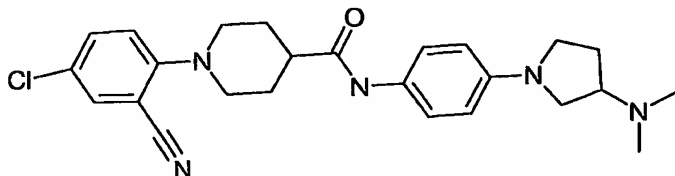


- 15 Piperidine-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid (30 mg), 2,5-Dichlorpyridin (30 mg) und Tributylamin (0,2 mL) wurden für 2 Stunden auf 160°C erhitzt. Das abgekühlte Rohgemisch wurde mit Heptan gewaschen und durch Chromatographie (Kieselgel, Eluent: Ethylacetat / Ammoniak (3N in Methanol)) gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 427,98 (C<sub>23</sub>H<sub>30</sub>ClN<sub>5</sub>O); MS (ESI): 428 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

## Beispiel 324

1-(4-Chlor-2-cyano-phenyl)-piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid

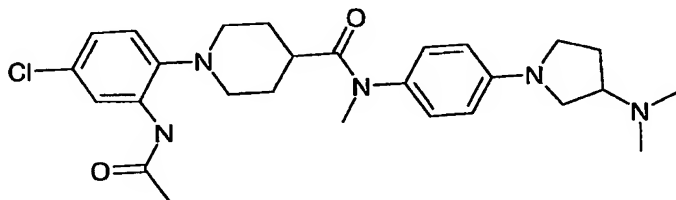


- 5 Piperidine-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid wurde wie im Beispiel 323 beschrieben mit 2,5-Dichlorbenzonitril umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 452,00 (C<sub>25</sub>H<sub>30</sub>ClN<sub>5</sub>O); MS (ESI): 452 (M+H<sup>+</sup>).

10

## Beispiel 325

1-(2-Acetylamino-4-chlor-phenyl)-piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-methyl-amid



- 15 Zu einer Lösung von 1-(4-Chlor-2-nitro-phenyl)-piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-methyl-amid (50 mg) in Eisessig (5 mL) wurde Palladium auf Kohle (10%ig; 10 mg) hinzugefügt. Die Lösung wurde unter einer Atmosphäre von Wasserstoff (1 bar) gerührt und mit Acetanhydrid (14  $\mu$ L) versetzt. Nach einer Stunde wurde weiteres Acetanhydrid (6  $\mu$ L) zugesetzt und die
- 20 Mischung noch 15 Minuten gerührt. Die Suspension wurde filtriert und das Filtrat eingengt. Der Rückstand wurde durch Chromatographie (Kieselgel, Eluent: Ethylacetat / Ammoniak (7N in Methanol)) gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 498,07 (C<sub>27</sub>H<sub>36</sub>ClN<sub>5</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 498 (M+H<sup>+</sup>).
- 25 Die folgenden Beispiele wurden analog dargestellt.

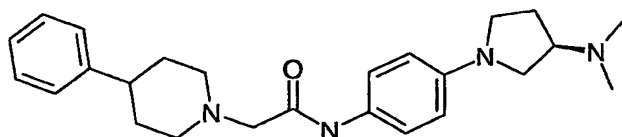
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Molekulargewicht	M+H+
326		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	481,62	482
327		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> ClN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	484,05	484
328		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	467,59	468

## Beispiel 329

(R)-N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-2-(4-phenyl-piperidin-1-yl)-acetamid

5



Zu einer Lösung von (R)-2-Chlor-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-acetamid (80 mg) in Acetonitril (5 mL) und DMF (1 mL) wurden Cäsiumcarbonat (100 mg) und 4-Phenylpiperidin (48 mg) gegeben und die Mischung für 12

10 Stunden bei 65°C gehalten. Die Mischung wurde von flüchtigen Anteilen befreit und der Rückstand zwischen Wasser und Dichlormethan verteilt. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch Chromatographie (Kieselgel, Eluent: Methanol / Dichlormethan) gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 406,58

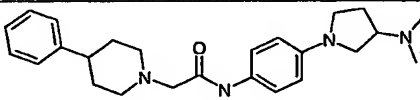
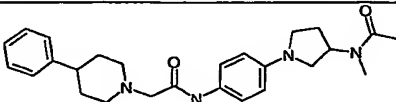
15 (C<sub>25</sub>H<sub>34</sub>N<sub>4</sub>O); MS (ESI): 407 (M+H+).

APD62429PC

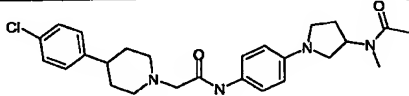
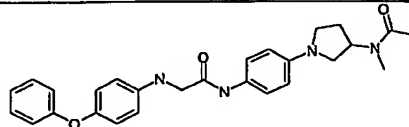
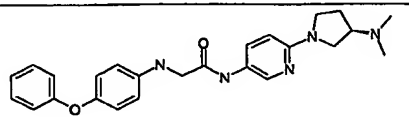
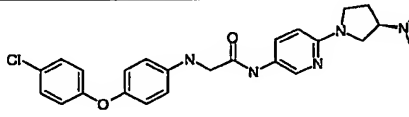
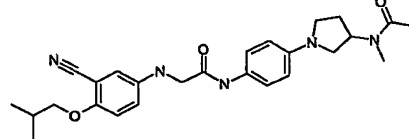
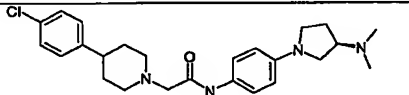
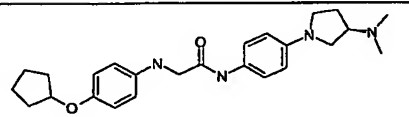
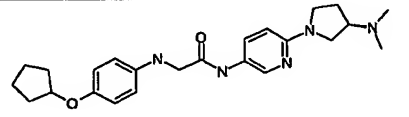
Alternativ können Kaliumcarbonat oder Pyridin als Hilfsbasen eingesetzt, Kaliumiodid als Katalysator zugesetzt, oder die Reaktion bei 150°C in einer Mikrowellenapparatur durchgeführt werden.

- 5 (R)-2-Chlor-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-acetamid  
 Zu einer Lösung von (R)- [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin (3,15 g) in Dichlormethan (120 mL) wurde Triethylamin (2,03 g) gegeben und dann Chloracetylchlorid (2,26 g) zugetropft. Nach 3 Stunden wurde die Mischung mit Dichlormethan verdünnt und mit Wasser und einer Kochsalzlösung gewaschen.
- 10 Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch Chromatographie (Kieselgel, Eluent: Methanol / Dichlormethan) gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 281,79 (C<sub>14</sub>H<sub>20</sub>ClN<sub>3</sub>O); MS (ESI): 282 (M+H<sup>+</sup>).  
 Analog wurden erhalten:
- 15 N-[4-[3-(Acetyl-methyl-amino)-pyrrolidin-1-yl]-phenyl]-2-chlor-acetamid  
 2-Chlor-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-acetamid  
 (R)-2-Chlor-N-[6-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-acetamid

- Die folgenden Beispiele wurden analog der in Beispiel 329 gegebenen Vorschrift  
 20 hergestellt:

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Molekulargewicht	M+H <sup>+</sup>
330		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	406,58	407
331		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,59	435

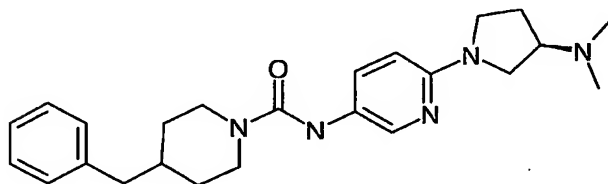
APD62429PC

332		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	469,03	469
333		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	458,57	459
334		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	431,54	432
335		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> ClN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	465,99	466
336		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	463,59	464
337		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> ClN <sub>4</sub> O	441,02	441
338		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	422,58	423
339		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	423,56	424

## Beispiel 340

(R)-4-Benzyl-piperidin-1-carbonsäure [6-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-yl]-amid

5

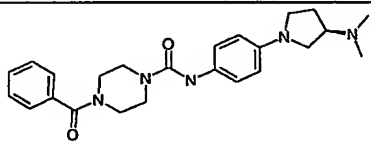
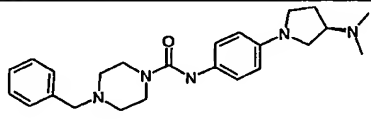
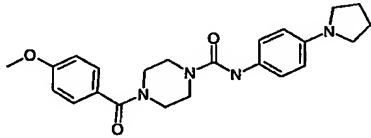
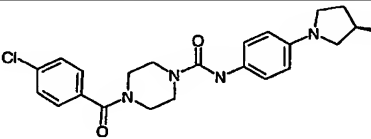
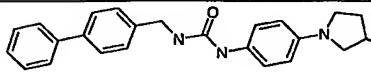
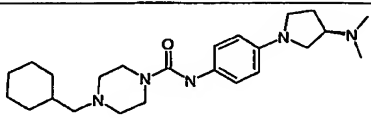




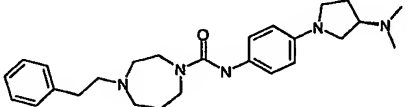
APD62429PC

Zu einer Lösung von Carbonyldiimidazol (53 mg) in DMF (0,5 mL) bei 0°C wurde (R)-6-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-3-ylamine gegeben. Nach 15 Minuten wurde 4-Benzylpiperidin (57 mg) zugesetzt und die Mischung für eine Stunde auf 90°C erhitzt. Die abgekühlte Mischung wurde von flüchtigen Anteilen befreit. Der Rückstand wurde durch Chromatographie (Kieselgel, Eluent: Methanol / Dichlormethan) gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 407,56 (C<sub>24</sub>H<sub>33</sub>N<sub>5</sub>O); MS (ESI): 408 (M+H<sup>+</sup>).

Analog wurden folgende Beispiele dargestellt:

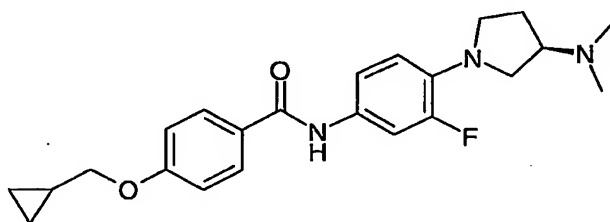
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Molekulargewicht	M+H <sup>+</sup>
341		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	421,55	422
342		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O	407,56	408
343		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	450,59	451
344		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	455,00	455
345		C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O	414,56	415
346		C <sub>24</sub> H <sub>39</sub> N <sub>5</sub> O	413,61	414

APD62429PC

347		C <sub>26</sub> H <sub>37</sub> N <sub>5</sub> O	435,62	436
-----	---	--	--------	-----

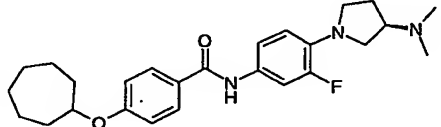
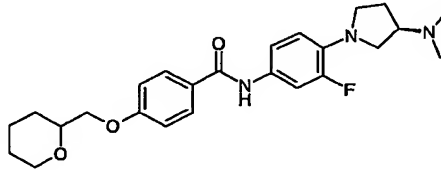
## Beispiel 348

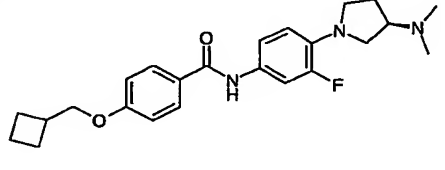
(R)-4-Cyclopropylmethoxy-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-3-fluor-phenyl]-benzamid  
5 benzamid



(R)-4-Benzoyloxy-N-[4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-3-fluor-phenyl]-benzamid  
wurde nach Methode B debenzylierend hydriert. Das erhaltene (R)-N-[4-(3-  
Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-3-fluoro-phenyl]-4-hydroxy-benzamid wurde nach  
10 Methode H mit Cyclopropylmethylbromid alkyliert. Man erhielt so das Produkt mit  
dem Molekulargewicht 397,50 (C<sub>23</sub>H<sub>28</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 398 (M+H<sup>+</sup>).

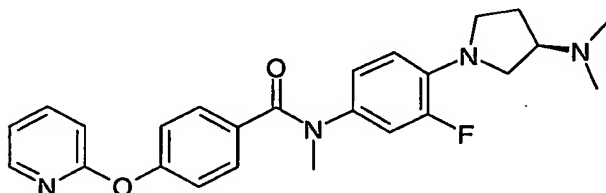
Nach Methode H wurden ebenfalls folgende Beispiele erhalten:

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Molekulargewicht	M+H <sup>+</sup>
349		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	439,58	440
350		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	441,55	442

351		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	411,52	412
-----	---	--	--------	-----

## Beispiel 352

(R)-N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-3-fluor-phenyl]-4-(pyridin-2-yloxy)-benzamid



(R)-N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-3-fluor-phenyl]-4-hydroxy-benzamid wurde nach Methode R mit 2-Chlorpyridin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 434,52 (C<sub>25</sub>H<sub>27</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 435 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 353 – Beispiel 507

Nach Methode A wurden verschiedene Pyrrolidinylaniline mit diversen Aminen umgesetzt. Die erhaltenen Produkte sind in Tabelle 6 zusammengefasst.

## Beispiel 508 – Beispiel 1130

Nach den Methoden E wurden verschiedene Pyrrolidinylaniline mit diversen Säuren umgesetzt. Die erhaltenen Produkte sind in Tabelle 7 zusammengefasst.

## Beispiel 1131 – Beispiel 1232

Nach den Methoden O wurden verschiedene (Hetero-)Arylhalogenide mit diversen Boronsäuren umgesetzt. Die erhaltenen Produkte sind in Tabelle 8 zusammengefasst.

## Beispiel 1233 – Beispiel 1237

APD62429PC

Nach den Methoden J wurden verschiedene Arylhalogenide mit diversen Acetylenen umgesetzt. Die erhaltenen Produkte sind in Tabelle 9 zusammengefasst.

#### 5 Beispiel 1238 – Beispiel 1403

Nach der Methode N wurden verschiedene Aminopyrrolidine und N-Arylpyrrolidinone mit diversen Aldehyden, Ketonen bzw. Aminen umgesetzt. Die erhaltenen Produkte sind in Tabelle 10 zusammengefasst.

#### 10 Beispiel 1404 – Beispiel 1423

Nach der Methode E wurden verschiedene Aminopyrrolidine mit Formaldehyd reaktiv methyliert. Die erhaltenen Produkte sind in Tabelle 11 zusammengefasst.

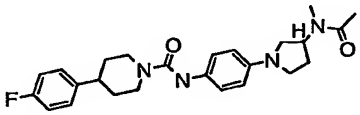
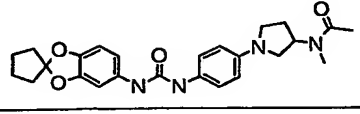
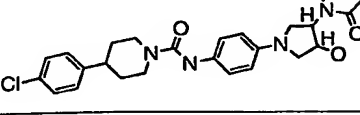
#### Beispiel 1424 – Beispiel 1443

#### 15 Nach der Methode F wurden verschiedene Amide alkyliert. Die erhaltenen Produkte sind in Tabelle 12 zusammengefasst.

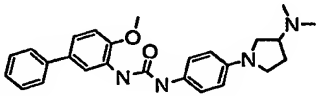
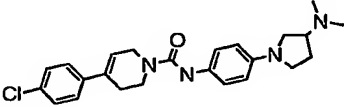
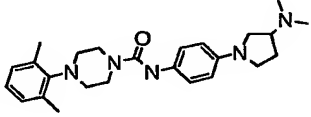
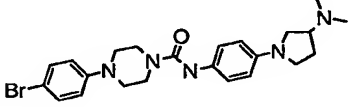
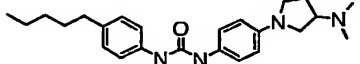
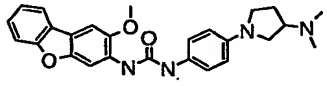
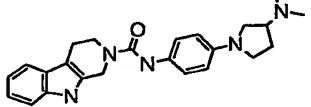
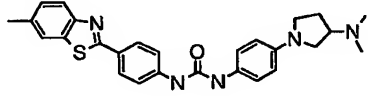
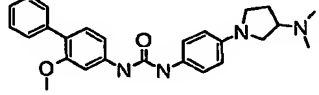
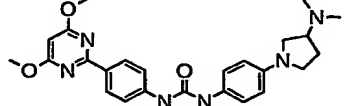
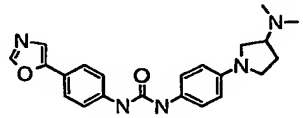
#### Beispiel 1444 – Beispiel 1618

#### 20 Nach der Methode G wurden verschiedene Carbaminsäure tert-butylester gespalten. Die erhaltenen Produkte sind in Tabelle 13 zusammengefasst.

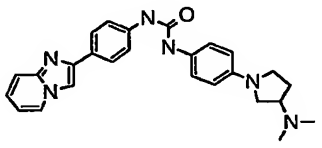
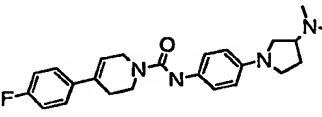
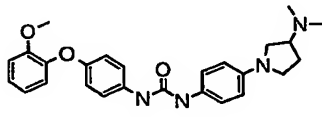
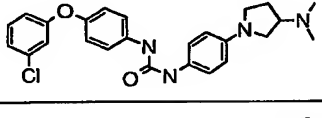
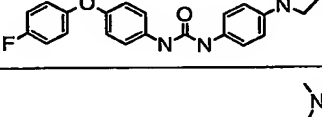
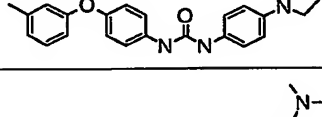
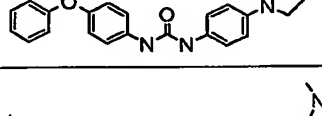
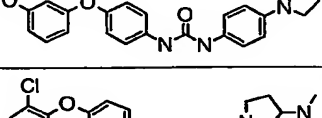
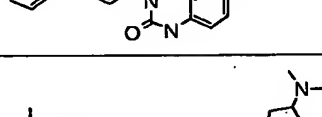
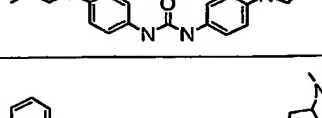
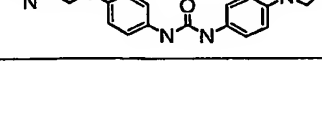
Tabelle 6

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
353		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	438,24	439
354		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	450,23	451
355		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	470,21	471

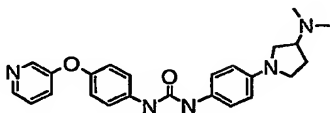
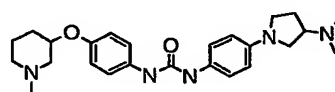
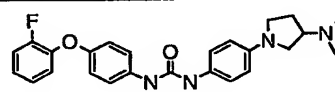
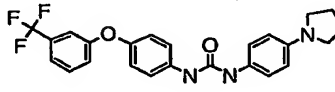
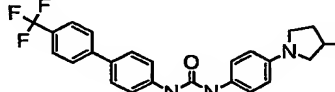
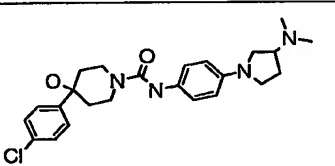
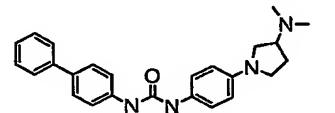
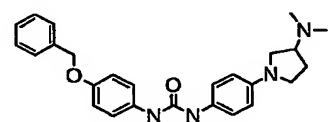
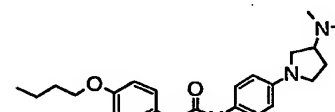
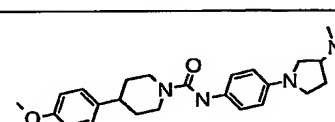
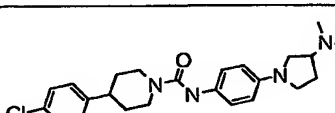
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
356		C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	430,24	431
357		C <sub>24</sub> H <sub>29</sub> ClN <sub>4</sub> O	424,20	425
358		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O	421,28	422
359		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> BrN <sub>5</sub> O	471,16	472
360		C <sub>24</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	394,27	395
361		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	444,22	445
362		C <sub>24</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O	403,24	404
363		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> OS	471,21	472
364		C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	430,24	431
365		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>6</sub> O <sub>3</sub>	462,24	463
366		C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	391,20	392

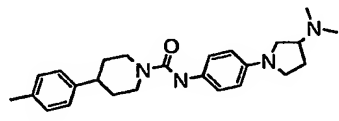
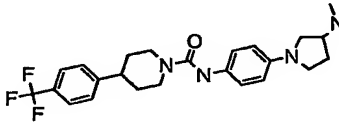
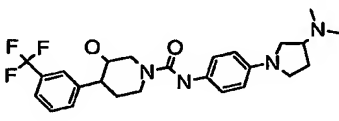
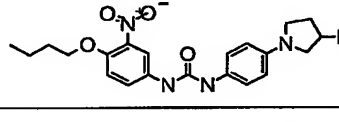
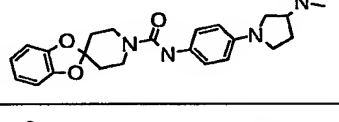
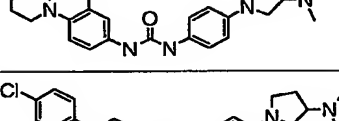
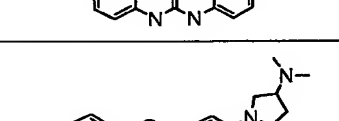
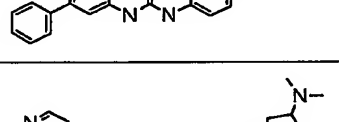
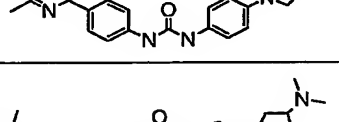
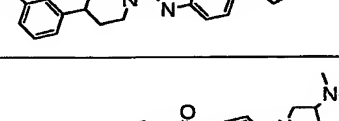
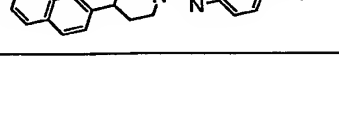
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
367		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> N <sub>6</sub> O	440,23	441
368		C <sub>24</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O	408,23	409
369		C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	446,23	447
370		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	450,18	451
371		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,21	435
372		C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	430,24	431
373		C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	430,24	431
374		C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	446,23	447
375		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	450,18	451
376		C <sub>23</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	396,25	397
377		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	431,23	432

APD62429PC

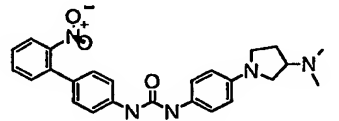
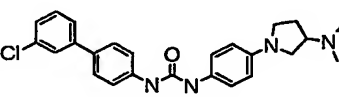
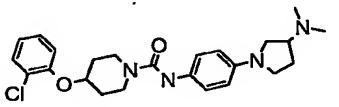
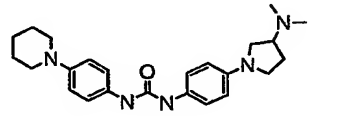
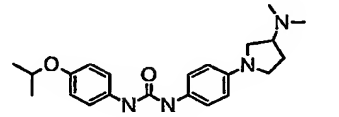
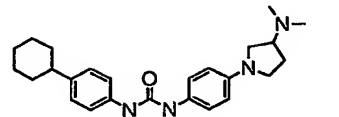
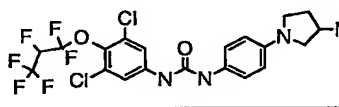
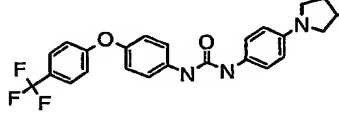
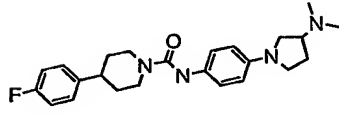
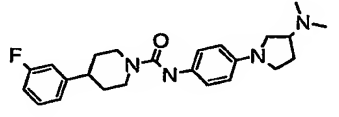
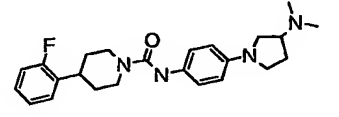
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
378		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	417,22	418
379		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	437,28	438
380		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,21	435
381		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	484,21	485
382		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O	468,21	469
383		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,21	443
384		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O	400,23	401
385		C <sub>26</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	430,24	431
386		C <sub>23</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	396,25	397
387		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	422,27	423
388		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O	426,22	427

APD62429PC

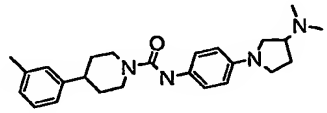
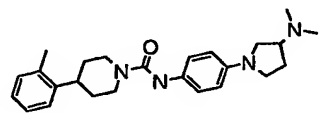
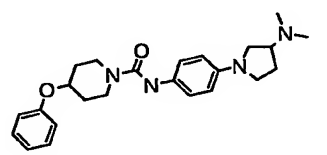
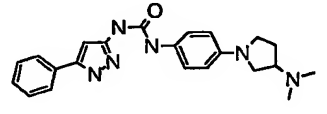
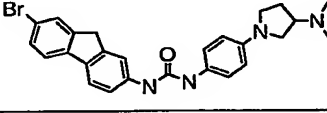
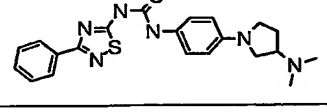
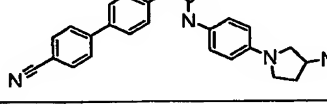
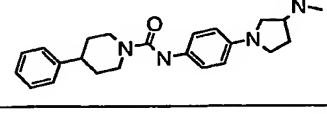
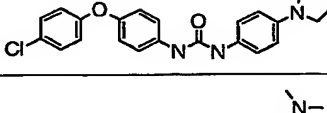
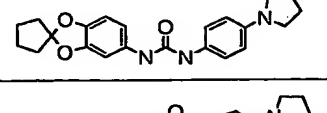
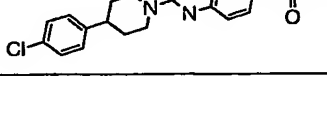
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
389		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	406,27	407
390		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O	460,24	461
391		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	476,24	477
392		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub>	441,24	442
393		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	422,23	423
394		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> ClN <sub>5</sub> O	441,23	442
395		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O	434,19	435
396		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O	400,23	401
397		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>6</sub> O	416,23	417
398		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	422,27	423
399		C <sub>28</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	442,27	443



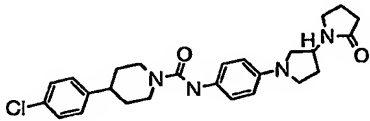
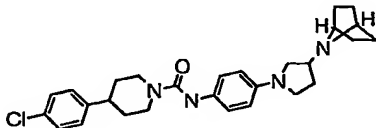
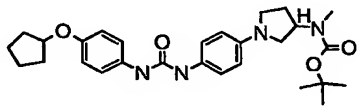
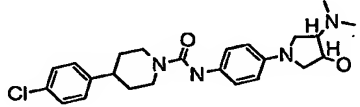
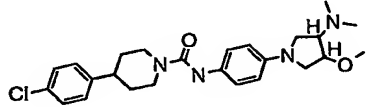
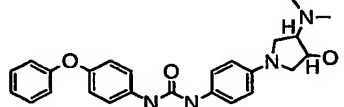
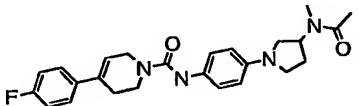
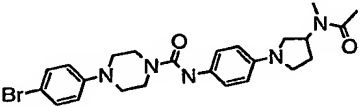
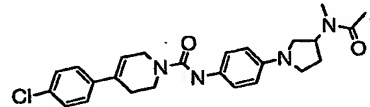
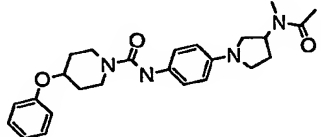
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
400		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	445,21	446
401		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O	434,19	435
402		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,21	443
403		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O	407,27	408
404		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	382,24	383
405		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	406,27	407
406		C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> Cl <sub>2</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	558,10	559
407		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	484,21	485
408		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O	410,25	411
409		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O	410,25	411
410		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O	410,25	411

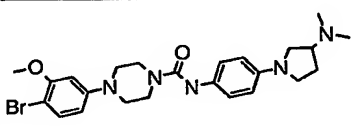
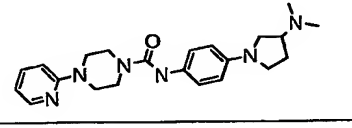
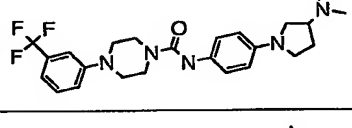
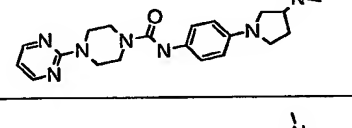
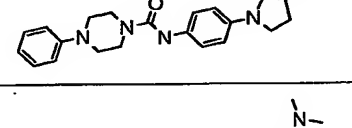
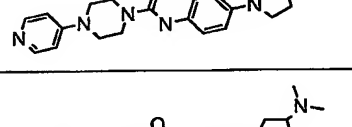
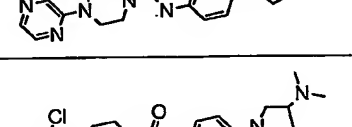
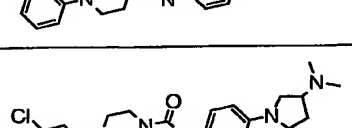
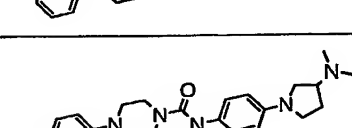
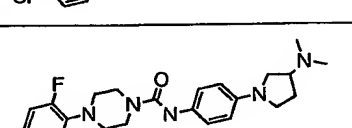

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
411		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	406,27	407
412		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	406,27	407
413		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	408,25	409
414		C <sub>22</sub> H <sub>26</sub> N <sub>6</sub> O	390,22	391
415		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> BrN <sub>4</sub> O	490,14	491
416		C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> N <sub>6</sub> OS	408,17	409
417		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O	425,22	426
418		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O	392,26	393
419		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	450,18	451
420		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	422,23	423
421		C <sub>24</sub> H <sub>29</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	440,20	441

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
422		C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	466,21	467
423		C <sub>28</sub> H <sub>35</sub> ClN <sub>4</sub> O	478,25	479
424		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	494,29	495
425		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,21	443
426		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	456,23	457
427		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	432,22	433
428		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	436,23	437
429		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> BrN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	499,16	500
430		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	452,20	453
431		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	436,25	437

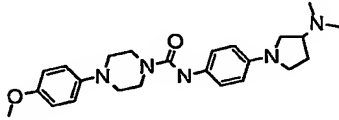
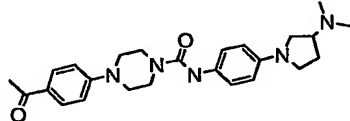
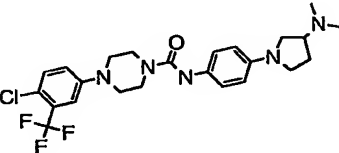
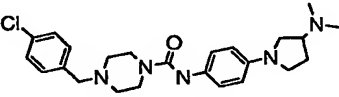
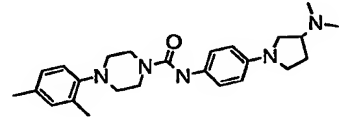
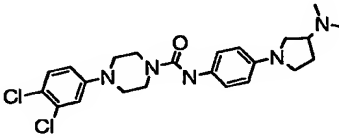
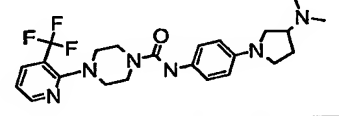
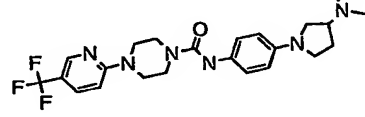
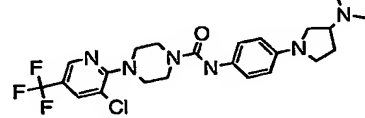
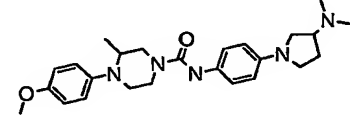
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
432		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> BrN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	501,17	502
433		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>6</sub> O	394,25	395
434		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O	461,24	462
435		C <sub>21</sub> H <sub>29</sub> N <sub>7</sub> O	395,24	396
436		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O	393,25	394
437		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>6</sub> O	394,25	395
438		C <sub>21</sub> H <sub>29</sub> N <sub>7</sub> O	395,24	396
439		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> ClN <sub>5</sub> O	427,21	428
440		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> ClN <sub>5</sub> O	427,21	428
441		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> ClN <sub>5</sub> O	427,21	428
442		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O	411,24	412

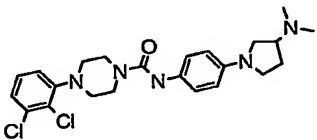
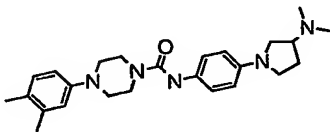
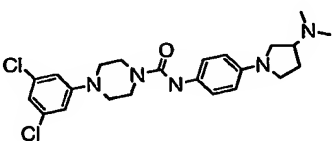
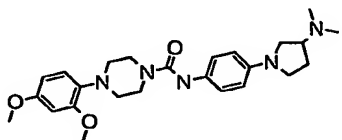
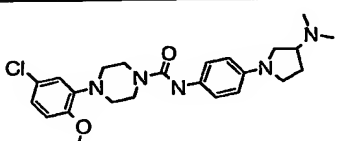
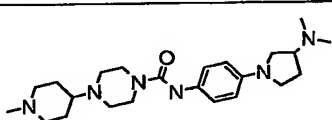
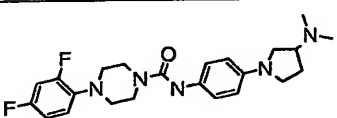
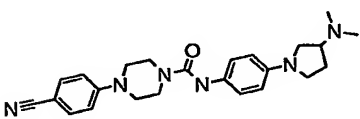
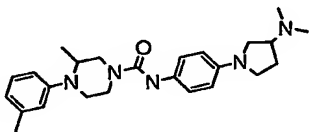
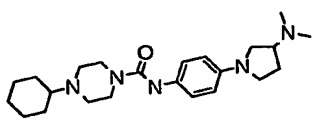
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
443		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>5</sub> O	411,24	412
444		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O	407,27	408
445		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O	407,27	408
446		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O	407,27	408
447		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O	407,27	408
448		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O	461,24	462
449		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O	461,24	462
450		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>6</sub> O	418,25	419
451		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	423,26	424
452		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	423,26	424

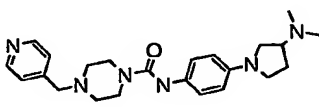
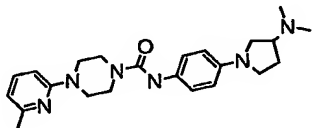
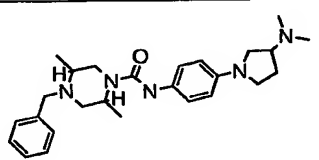
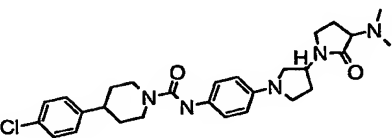
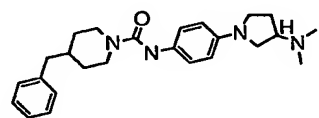
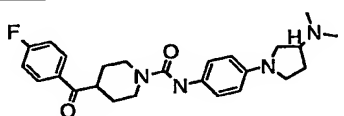
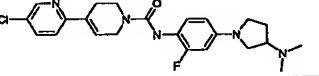
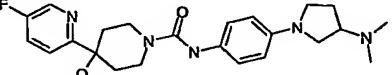
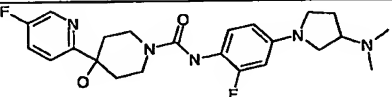
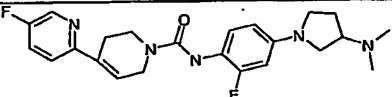
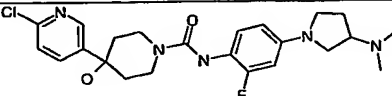
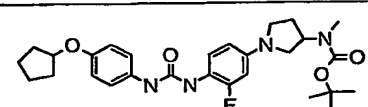
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
453		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	423,26	424
454		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	435,26	436
455		C <sub>24</sub> H <sub>29</sub> ClF <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O	495,20	496
456		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> ClN <sub>5</sub> O	441,23	442
457		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O	421,28	422
458		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>5</sub> O	461,17	462
459		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> F <sub>3</sub> N <sub>6</sub> O	462,24	463
460		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> F <sub>3</sub> N <sub>6</sub> O	462,24	463
461		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> ClF <sub>3</sub> N <sub>6</sub> O	496,20	497
462		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	437,28	438

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
463		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>5</sub> O	461,17	462
464		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O	421,28	422
465		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>5</sub> O	461,17	462
466		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	453,27	454
467		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> ClN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	457,22	458
468		C <sub>23</sub> H <sub>38</sub> N <sub>6</sub> O	414,31	415
469		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> F <sub>2</sub> N <sub>5</sub> O	429,23	430
470		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>6</sub> O	418,25	419
471		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O	421,28	422
472		C <sub>23</sub> H <sub>37</sub> N <sub>5</sub> O	399,30	400

APD62429PC

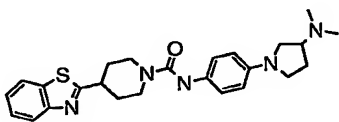
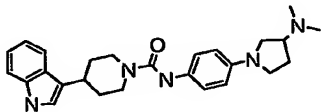
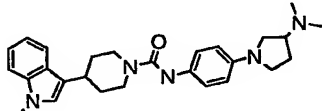
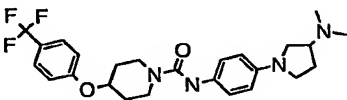
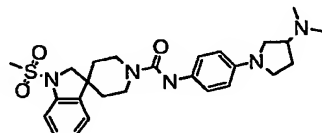
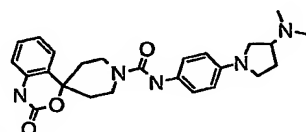
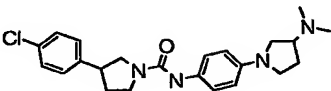
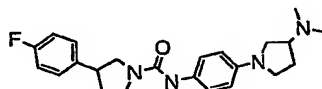
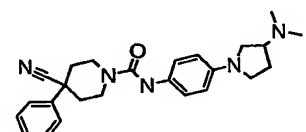
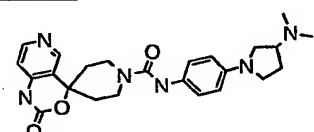
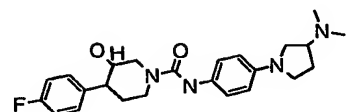
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
473		C <sub>23</sub> H <sub>32</sub> N <sub>6</sub> O	408,26	409
474		C <sub>23</sub> H <sub>32</sub> N <sub>6</sub> O	408,26	409
475		C <sub>26</sub> H <sub>37</sub> N <sub>5</sub> O	435,30	436
476		C <sub>28</sub> H <sub>36</sub> ClN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	509,26	510
477		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	406,27	407
478		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	438,24	439
479		C <sub>23</sub> H <sub>27</sub> ClFN <sub>5</sub> O	443,96	444
480		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	427,53	428
481		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> F <sub>2</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	445,52	446
482		C <sub>23</sub> H <sub>27</sub> F <sub>2</sub> N <sub>5</sub> O	427,50	428
483		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> ClFN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	461,97	462
484		C <sub>28</sub> H <sub>37</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	512,28	513



APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
485		C <sub>28</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>4</sub>	521,24	522
486		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> ClN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	443,98	444
487		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> ClFN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	461,97	462
488		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,27	435
489		C <sub>30</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O	468,29	469
490		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	450,26	451
491		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	420,25	421
492		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	450,26	451
493		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	434,23	435
494		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	449,28	450
495		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	451,24	452

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
496		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	449,23	450
497		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O	431,27	432
498		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O	445,28	446
499		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	476,24	477
500		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> S	497,25	498
501		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	449,24	450
502		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> ClN <sub>4</sub> O	412,20	413
503		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O	396,23	397
504		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O	417,25	418
505		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>6</sub> O <sub>3</sub>	450,24	451
506		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	426,24	427

APD62429PC

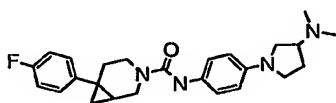
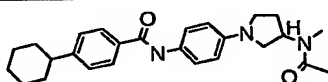
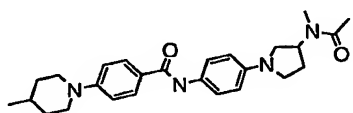
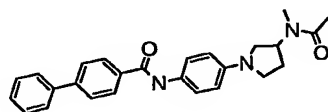
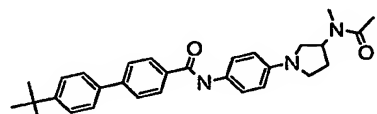
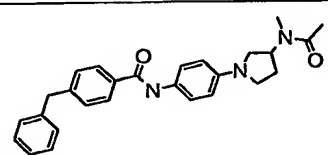
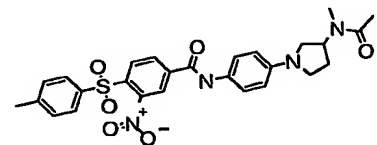
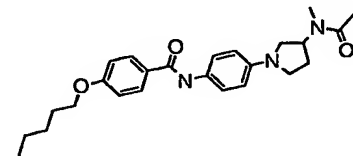
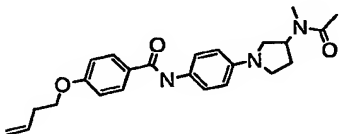
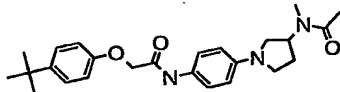
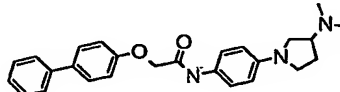
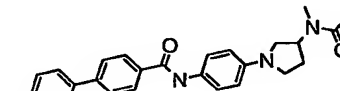
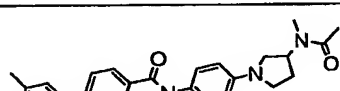
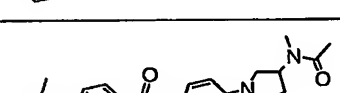
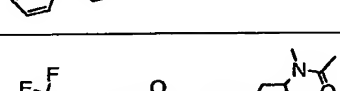
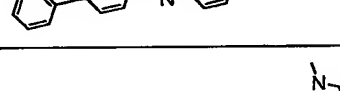
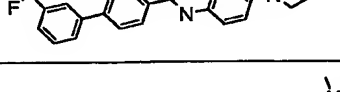
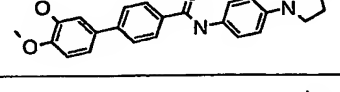
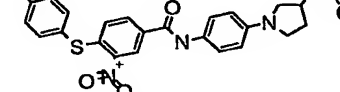
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
507		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> N <sub>4</sub> O	422,25	423

Tabelle 7

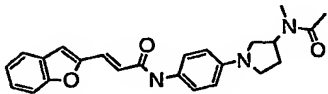
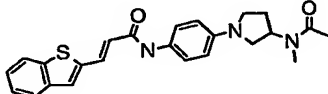
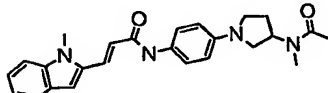
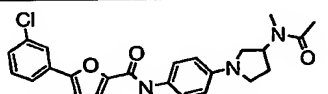
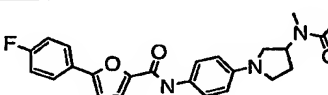
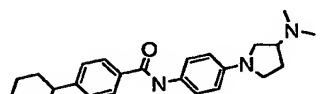
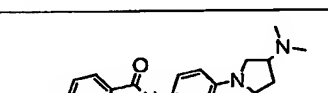
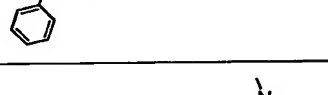
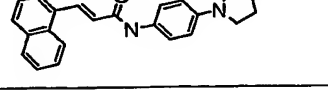
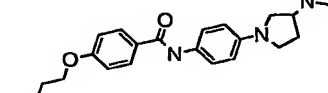
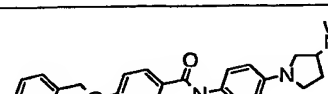
5

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
508		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	419,26	420
509		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,27	435
510		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,21	414
511		C <sub>30</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	469,27	470
512		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,23	428
513		C <sub>27</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>6</sub> S	536,17	537
514		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	423,25	424

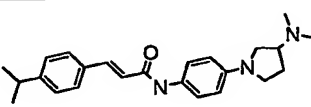
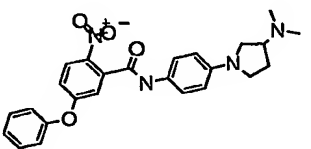
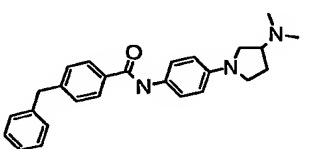
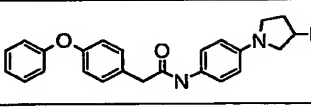
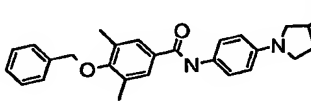
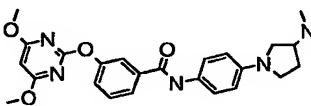
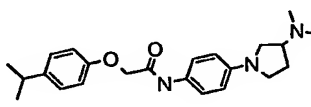
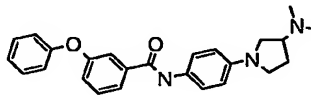
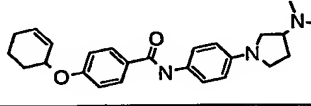
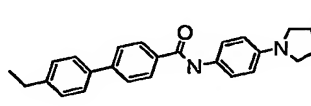
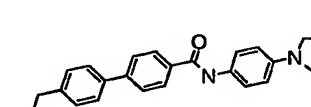
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
515		C <sub>24</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	407,22	408
516		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	423,25	424
517		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,22	444
518		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,23	428
519		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,23	428
520		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,23	428
521		C <sub>27</sub> H <sub>26</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	481,20	482
522		C <sub>27</sub> H <sub>26</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	481,20	482
523		C <sub>28</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	473,23	474
524		C <sub>27</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> S	504,18	505
525		C <sub>26</sub> H <sub>25</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	481,16	482

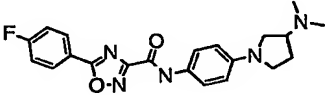
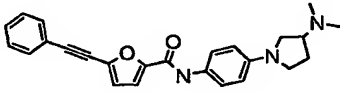
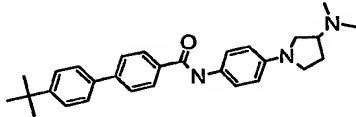
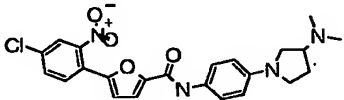
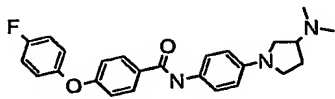
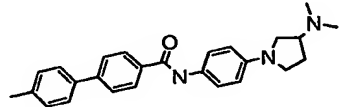
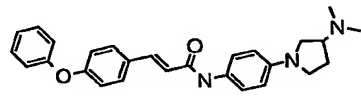
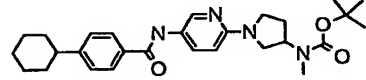
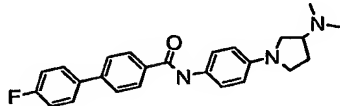
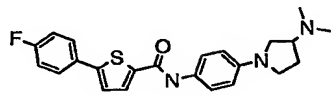
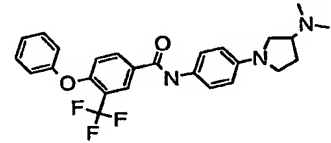
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
526		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	403,19	404
527		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	419,17	420
528		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	416,22	417
529		C <sub>24</sub> H <sub>24</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	437,15	438
530		C <sub>24</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	421,18	422
531		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O	391,26	392
532		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	401,21	402
533		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O	385,21	386
534		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	381,24	382
535		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,23	416
536		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O	385,21	386

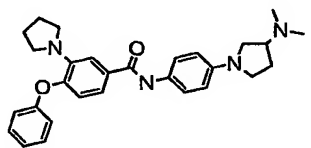
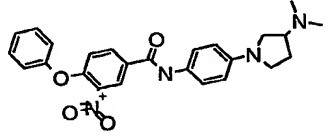
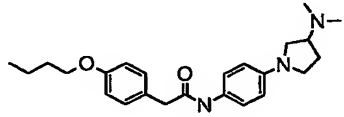
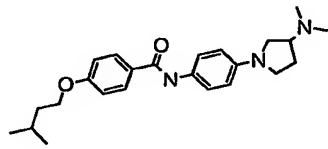
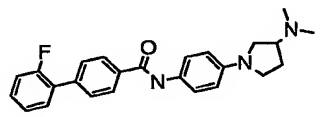
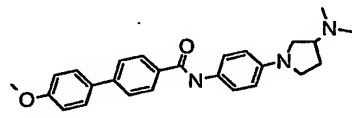
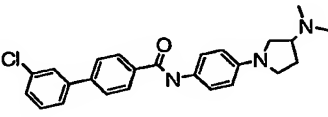
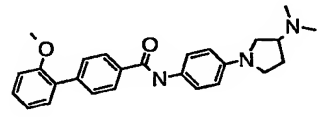
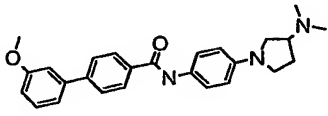
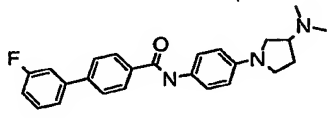
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
537		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O	377,25	378
538		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	446,20	447
539		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O	399,23	400
540		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,23	416
541		C <sub>28</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	443,26	444
542		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub>	463,22	464
543		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	381,24	382
544		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	401,21	402
545		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	405,24	406
546		C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O	413,25	414
547		C <sub>28</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O	427,26	428

APD62429PC

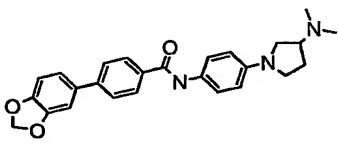
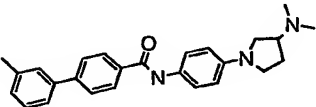
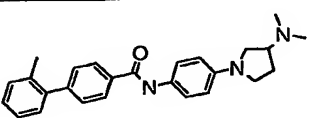
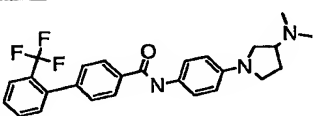
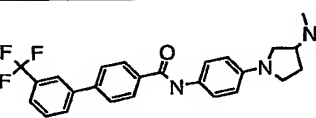
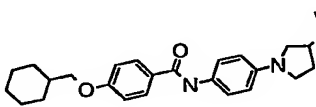
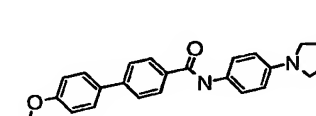
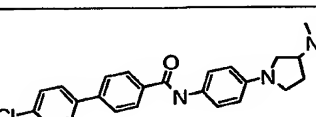
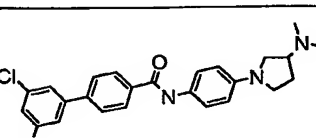
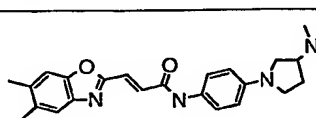
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
548		C <sub>21</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	395,18	396
549		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,20	400
550		C <sub>29</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O	441,28	442
551		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	454,14	455
552		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	419,20	420
553		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O	399,23	400
554		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,23	428
555		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	478,29	479
556		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O	403,21	404
557		C <sub>23</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> OS	409,16	410
558		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	469,20	470

APD62429PC

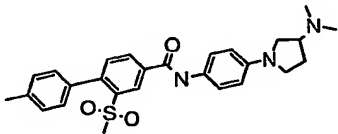
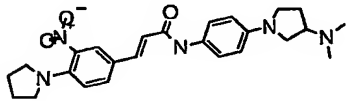
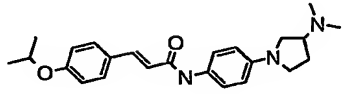
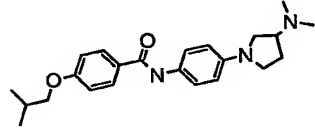
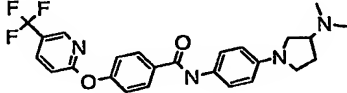
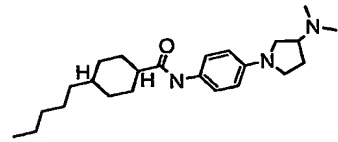
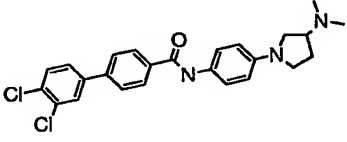
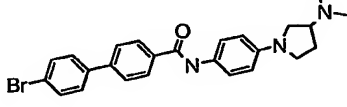
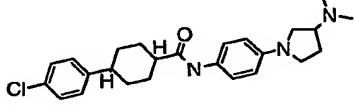
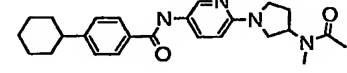
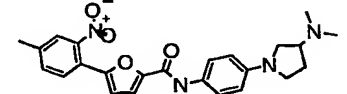
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
559		C <sub>29</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	470,27	471
560		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	446,20	447
561		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	395,26	396
562		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	395,26	396
563		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O	403,21	404
564		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,23	416
565		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>3</sub> O	419,18	420
566		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,23	416
567		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,23	416
568		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O	403,21	404



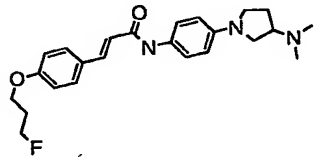
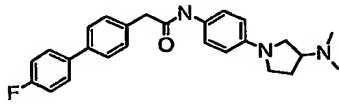
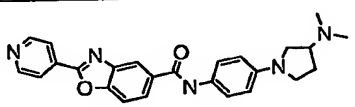
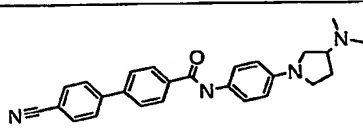
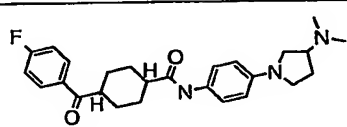
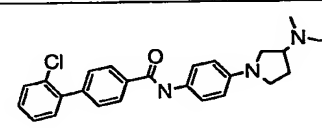
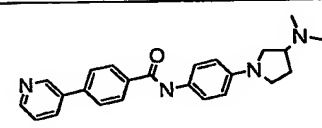
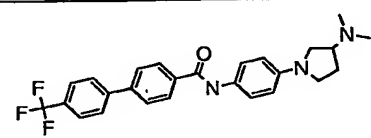
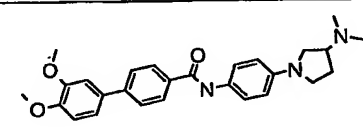
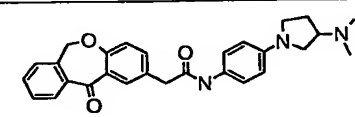
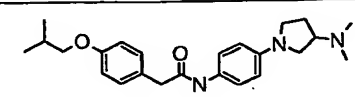
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
569		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	429,20	430
570		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O	399,23	400
571		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O	399,23	400
572		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O	453,20	454
573		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O	453,20	454
574		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	421,27	422
575		C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	429,24	430
576		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>3</sub> O	419,18	420
577		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	453,14	454
578		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	404,22	405

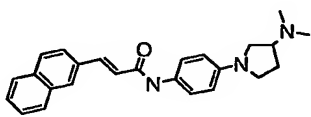
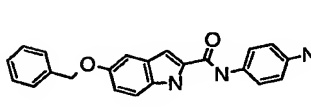
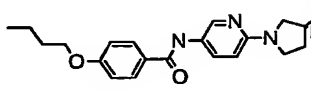
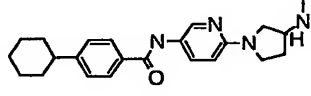
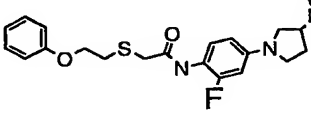
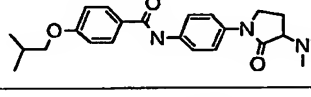
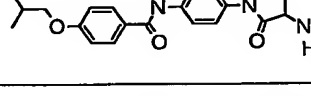
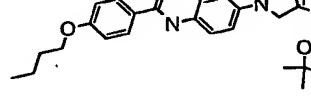
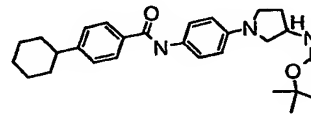
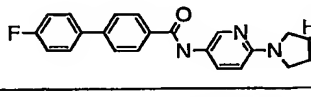
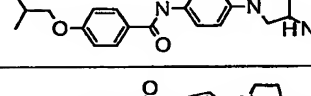
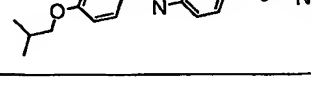
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
579		C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	477,21	478
580		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	449,24	450
581		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	393,24	394
582		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	381,24	382
583		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	470,19	471
584		C <sub>24</sub> H <sub>39</sub> N <sub>3</sub> O	385,31	386
585		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	453,14	454
586		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> BrN <sub>3</sub> O	463,13	464
587		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> ClN <sub>3</sub> O	425,22	426
588		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	420,25	421
589		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	434,20	435

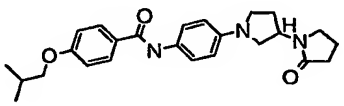
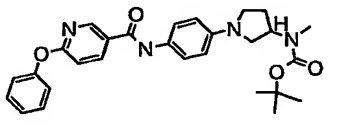
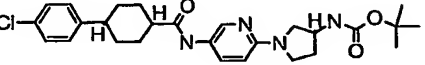
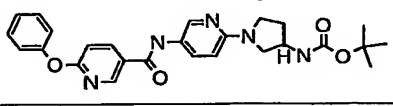
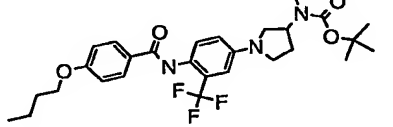
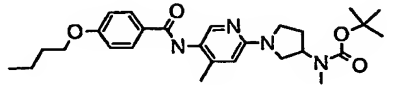
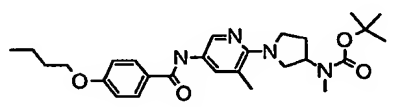
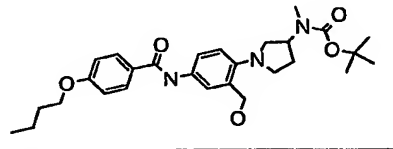
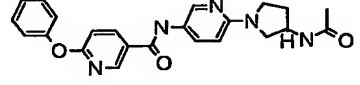
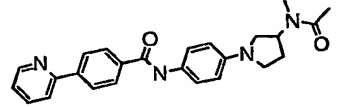
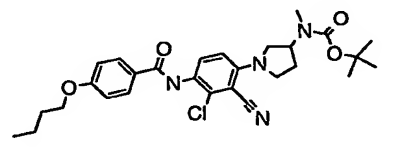
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
590		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	411,23	412
591		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O	417,22	418
592		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	427,20	428
593		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O	410,21	411
594		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	437,25	438
595		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>3</sub> O	419,18	420
596		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O	386,21	387
597		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O	453,20	454
598		C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	445,24	446
599		C <sub>28</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	455,22	456
600		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	395,26	396

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
601		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O	385,21	386
602		C <sub>28</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	454,24	455
603		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	468,27	469
604		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	478,29	479
605		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	417,55	418
606		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	395,22	396
607		C <sub>27</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	447,25	448
608		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	467,28	468
609		C <sub>29</sub> H <sub>39</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	477,30	478
610		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	476,22	477
611		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	454,26	455
612		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	433,27	434

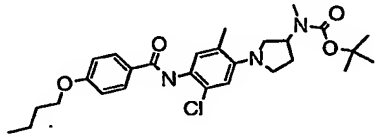
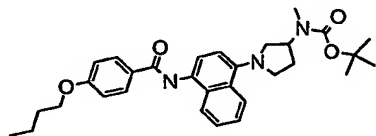
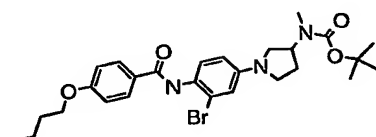
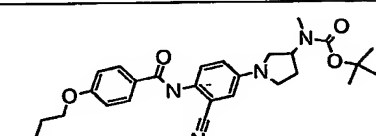
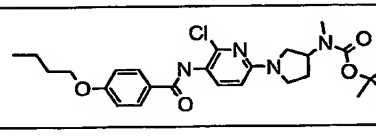
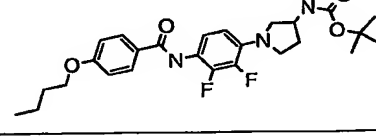
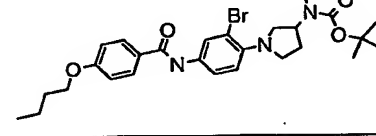
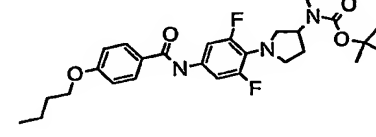
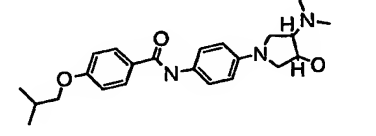
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
613		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	421,24	422
614		C <sub>28</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	488,24	489
615		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	498,24	499
616		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub>	475,22	476
617		C <sub>28</sub> H <sub>36</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	535,27	536
618		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	482,29	483
619		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	482,29	483
620		C <sub>28</sub> H <sub>39</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub>	497,29	498
621		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	417,18	418
622		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	414,21	415
623		C <sub>28</sub> H <sub>35</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	526,23	527

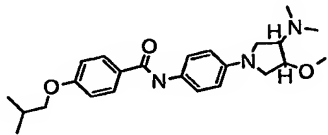
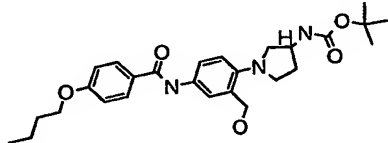
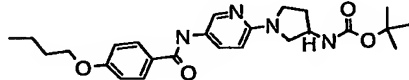
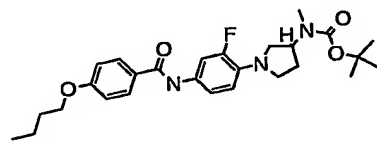
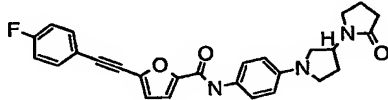
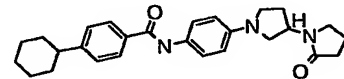
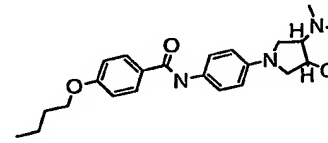
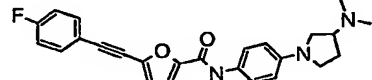
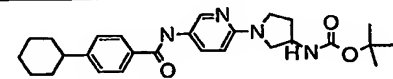
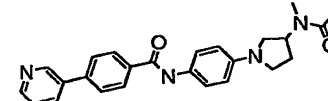
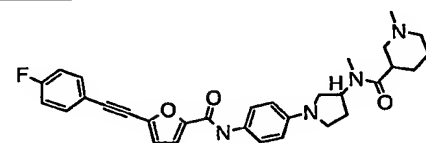
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
624		C <sub>28</sub> H <sub>39</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	481,29	482
625		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	501,24	502
626		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	503,26	504
627		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	485,27	486
628		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	485,27	486
629		C <sub>28</sub> H <sub>39</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	481,29	482
630		C <sub>28</sub> H <sub>36</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	535,27	536
631		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	519,23	520
632		C <sub>28</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	492,27	493

APD62429PC

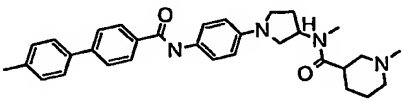
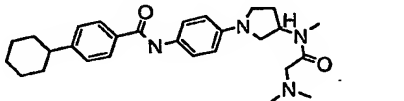
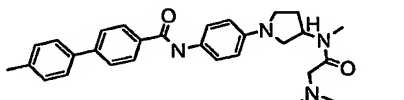
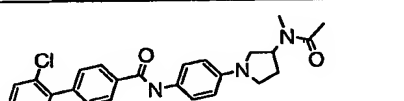
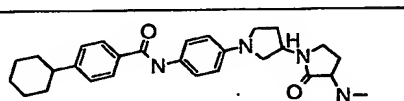
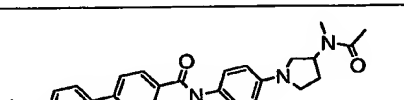
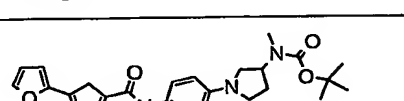
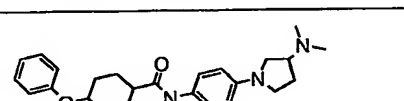
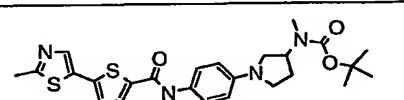
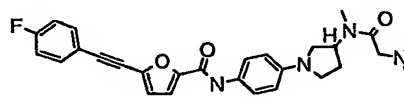
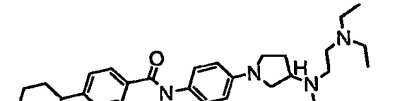
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
633		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	515,26	516
634		C <sub>31</sub> H <sub>39</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	517,29	518
635		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> BrN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	545,19	546
636		C <sub>28</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	492,27	493
637		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	502,23	503
638		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	503,26	504
639		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> BrN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	545,19	546
640		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	503,26	504
641		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	397,24	398

APD62429PC

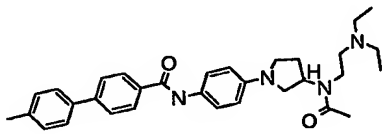
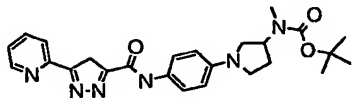
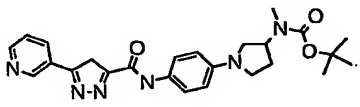
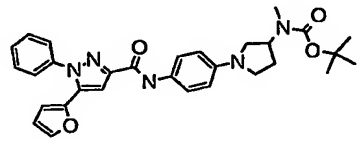
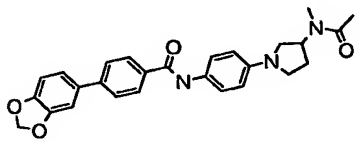
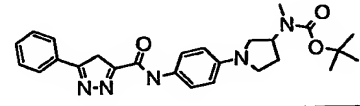
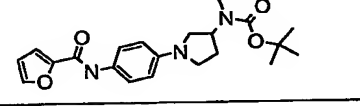
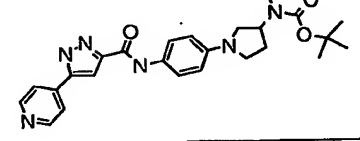
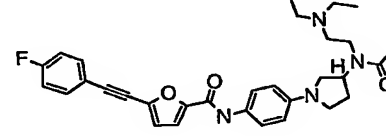
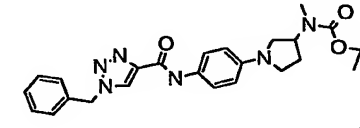
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
642		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	411,25	412
643		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub>	483,27	484
644		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	454,26	455
645		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	485,27	486
646		C <sub>27</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	457,18	458
647		C <sub>27</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	431,26	432
648		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	397,24	398
649		C <sub>25</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	417,18	418
650		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	464,28	465
651		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	414,21	415
652		C <sub>31</sub> H <sub>33</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	528,25	529



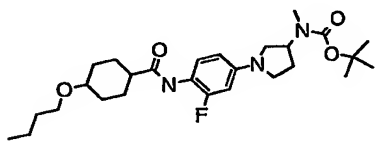
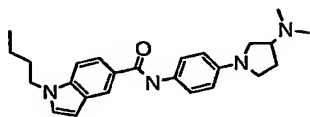
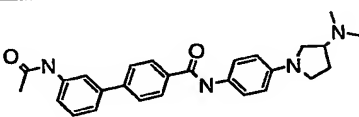
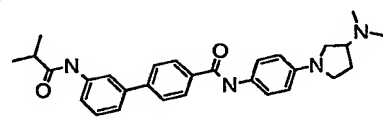
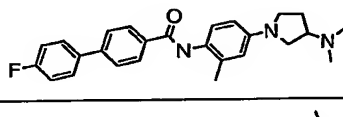
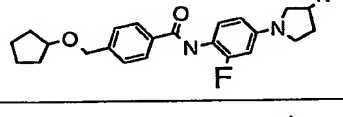
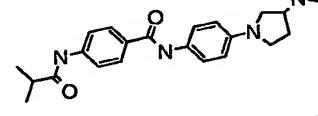
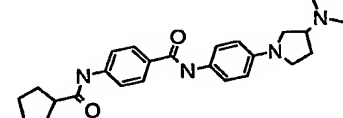
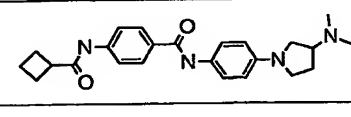
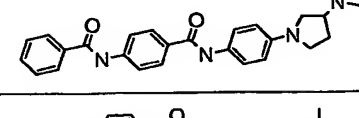
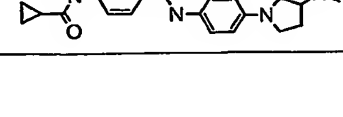
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
653		C <sub>32</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	510,30	511
654		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	462,30	463
655		C <sub>29</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	470,27	471
656		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	447,17	448
657		C <sub>29</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	474,30	475
658		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,22	444
659		C <sub>24</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub>	451,22	452
660		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	407,26	408
661		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S <sub>2</sub>	498,18	499
662		C <sub>28</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	488,22	489
663		C <sub>31</sub> H <sub>44</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	504,35	505

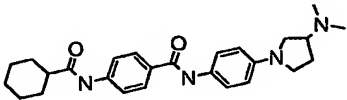
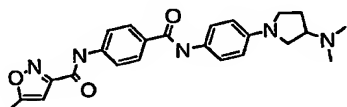
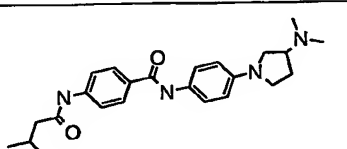
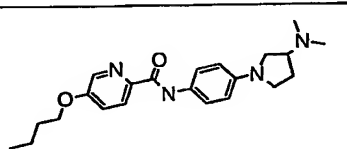
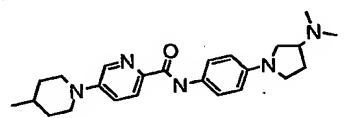
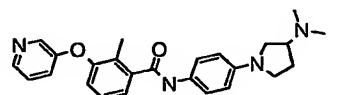
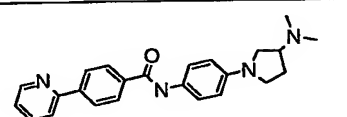
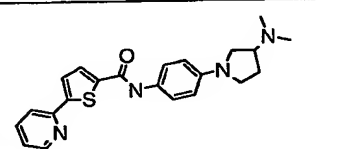
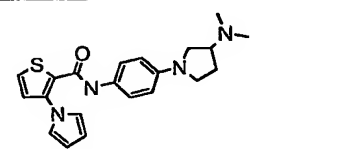
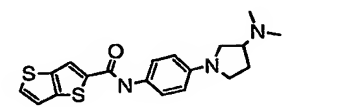
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
664		C <sub>32</sub> H <sub>40</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	512,32	513
665		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>6</sub> O <sub>3</sub>	462,24	463
666		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>6</sub> O <sub>3</sub>	462,24	463
667		C <sub>30</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub>	527,25	528
668		C <sub>27</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	457,20	458
669		C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	461,24	462
670		C <sub>21</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	385,20	386
671		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>6</sub> O <sub>3</sub>	462,24	463
672		C <sub>31</sub> H <sub>35</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	530,27	531
673		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>6</sub> O <sub>3</sub>	476,25	477

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
674		C <sub>27</sub> H <sub>42</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	491,32	492
675		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O	404,26	405
676		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,24	443
677		C <sub>29</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	470,27	471
678		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O	417,22	418
679		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	425,55	426
680		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	394,24	395
681		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	420,25	421
682		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	406,24	407
683		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	428,22	429
684		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	392,22	393

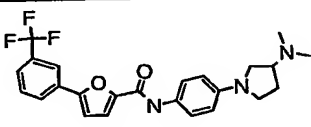
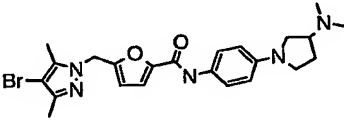
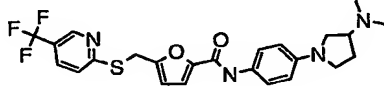
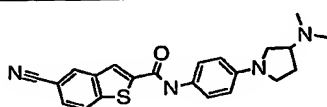
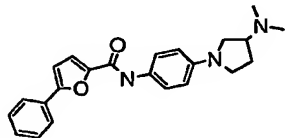
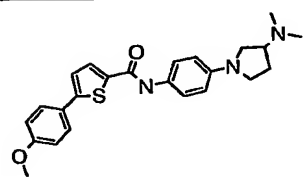
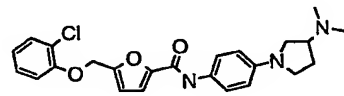
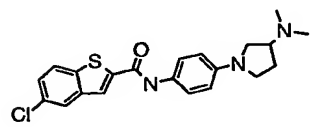
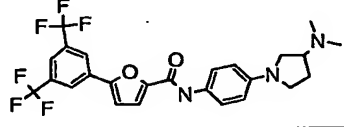
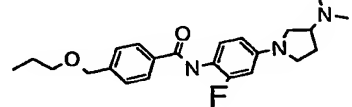
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
685		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,27	435
686		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	433,21	434
687		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	408,25	409
688		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	382,24	383
689		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O	407,27	408
690		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	416,22	417
691		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O	386,21	387
692		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> OS	392,17	393
693		C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> OS	380,17	381
694		C <sub>19</sub> H <sub>21</sub> N <sub>3</sub> OS <sub>2</sub>	371,11	372

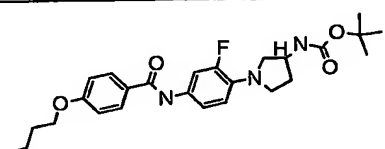
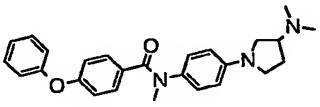
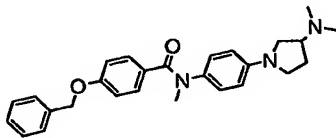
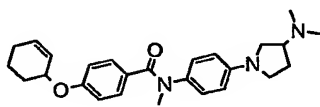
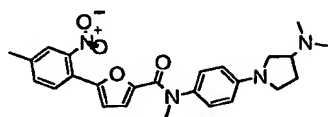
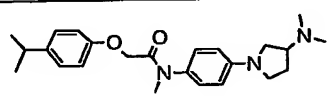
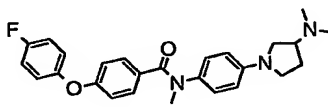
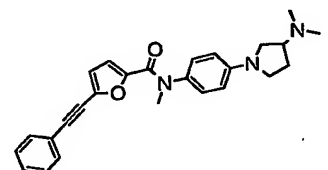
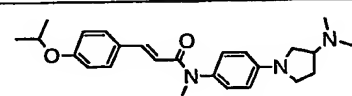
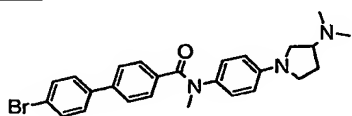
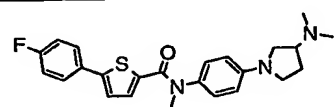
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
695		C <sub>23</sub> H <sub>24</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	409,16	410
696		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> ClN <sub>3</sub> OS	413,13	414
697		C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	417,11	418
698		C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	433,08	434
699		C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	444,10	445
700		C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	463,09	464
701		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	429,13	430
702		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	427,15	428
703		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	455,14	456
704		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub> S	463,17	464
705		C <sub>24</sub> H <sub>23</sub> ClF <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	477,14	478

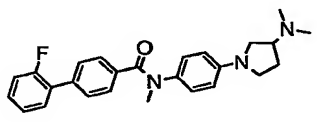
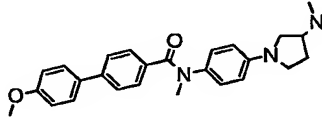
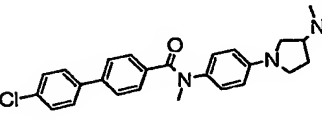
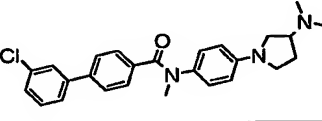
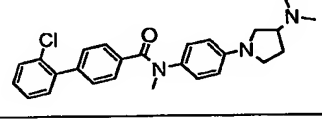
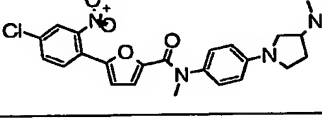
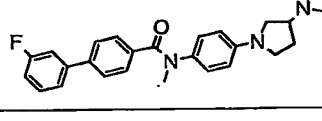
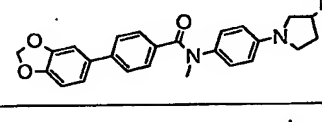
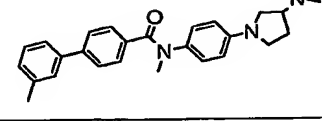
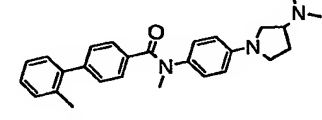
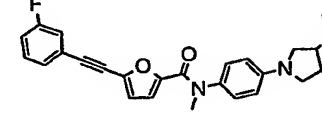
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
706		C <sub>24</sub> H <sub>24</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	443,18	444
707		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> BrN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	485,14	486
708		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	490,17	491
709		C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> OS	390,15	391
710		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	375,20	376
711		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	421,18	422
712		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	439,17	440
713		C <sub>21</sub> H <sub>22</sub> ClN <sub>3</sub> OS	399,12	400
714		C <sub>25</sub> H <sub>23</sub> F <sub>6</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	511,17	512
715		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,51	400

APD62429PC

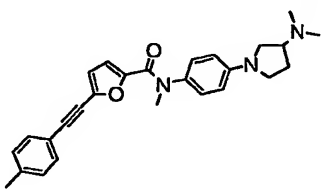
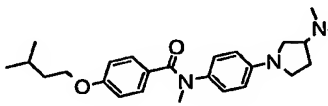
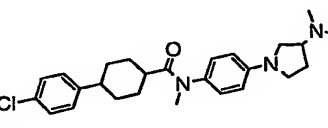
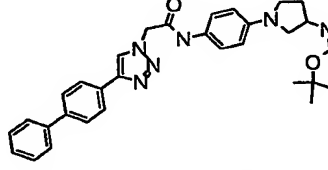
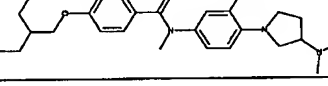
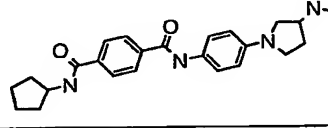
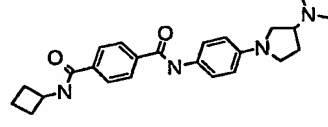
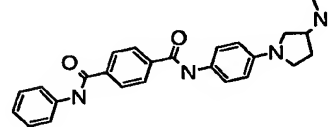
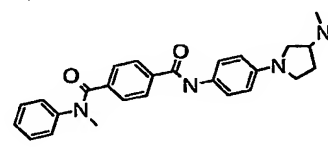
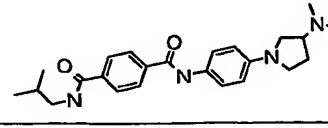
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
716		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	471,25	472
717		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,23	416
718		C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	429,24	430
719		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	419,26	420
720		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	448,21	449
721		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	395,26	396
722		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	433,22	434
723		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,21	414
724		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	407,26	408
725		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> BrN <sub>3</sub> O	477,14	478
726		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> OS	423,18	424

APD62429PC

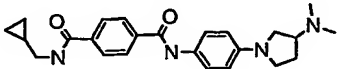
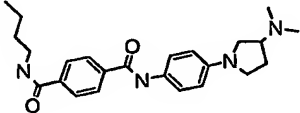
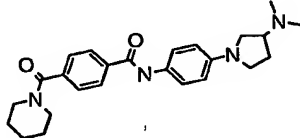
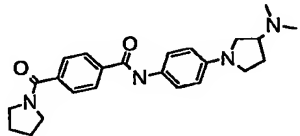
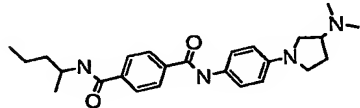
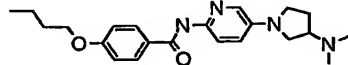
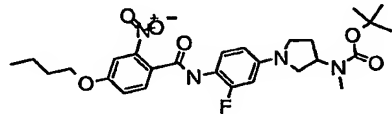
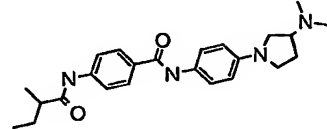
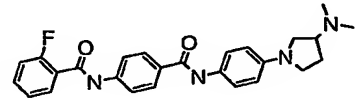
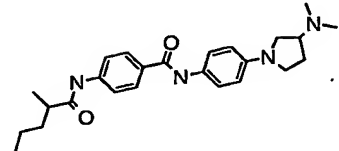
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
727		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O	417,22	418
728		C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	429,24	430
729		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> ClN <sub>3</sub> O	433,19	434
730		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> ClN <sub>3</sub> O	433,19	434
731		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> ClN <sub>3</sub> O	433,19	434
732		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	468,16	469
733		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O	417,22	418
734		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,22	444
735		C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O	413,25	414
736		C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O	413,25	414
737		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	431,20	432



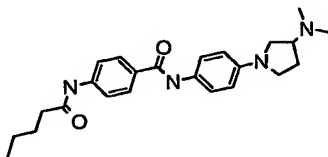
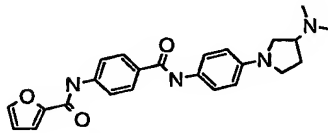
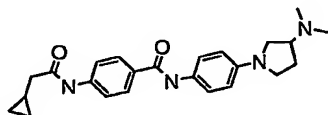
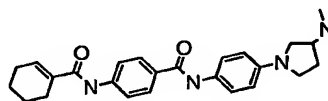
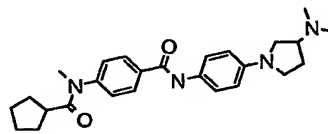
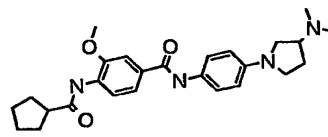
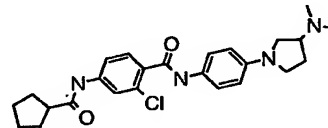
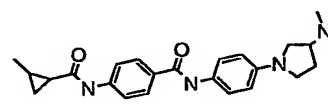
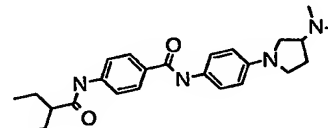
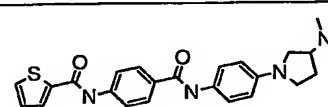
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
738		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,23	428
739		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	409,27	410
740		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> ClN <sub>3</sub> O	439,24	440
741		C <sub>32</sub> H <sub>36</sub> N <sub>6</sub> O <sub>3</sub>	552,28	553
742		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	411,59	412
743		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	420,25	421
744		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	406,24	407
745		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	428,22	429
746		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,24	443
747		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	408,25	409

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
748		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	406,24	407
749		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	408,25	409
750		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	420,25	421
751		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	406,24	407
752		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	422,27	423
753		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	382,24	383
754		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>6</sub>	530,25	531
755		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	408,25	409
756		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	446,21	447
757		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	422,27	423

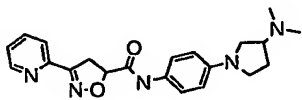
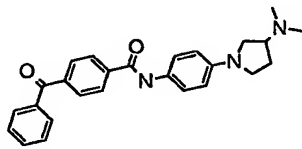
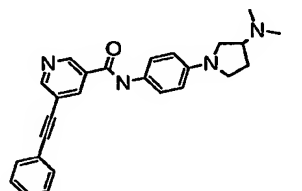
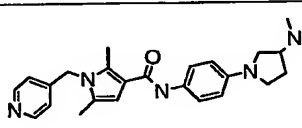
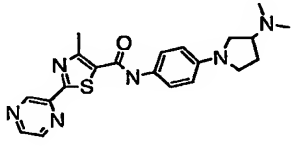
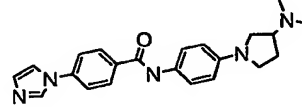
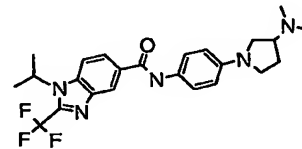
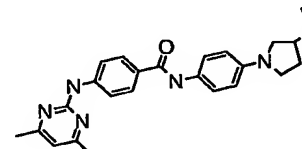
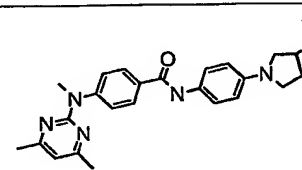
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
758		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	408,25	409
759		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	418,20	419
760		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	406,24	407
761		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	432,25	433
762		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,27	435
763		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	450,26	451
764		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	454,21	455
765		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	406,24	407
766		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	422,27	423
767		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	434,18	435

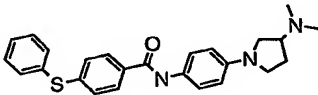
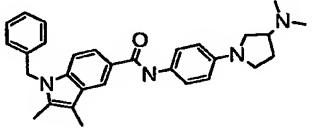
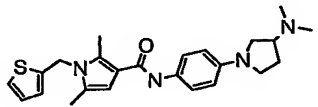
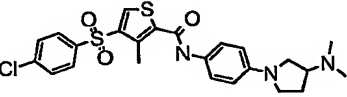
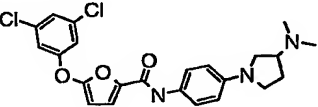
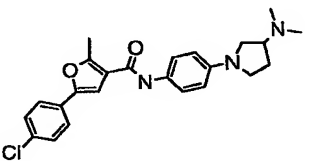
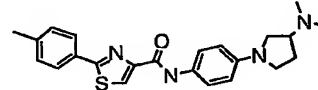
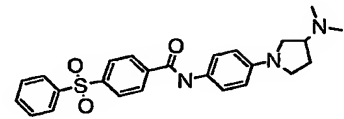
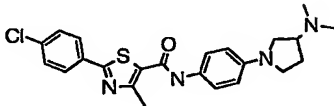
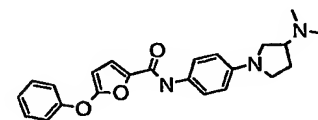
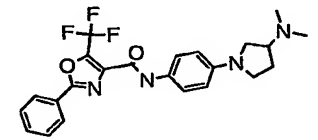
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
768		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,27	435
769		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,20	416
770		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,25	414
771		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	397,22	398
772		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	411,23	412
773		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	411,23	412
774		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	440,26	441
775		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	468,25	469
776		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O	374,21	375
777		C <sub>28</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O	438,24	439

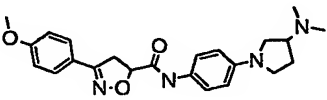
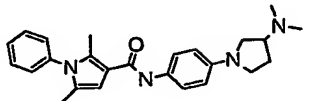
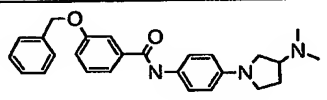
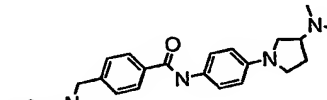
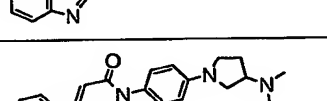
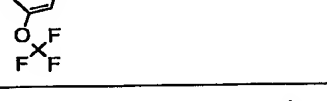
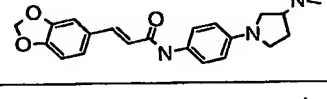
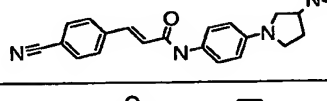
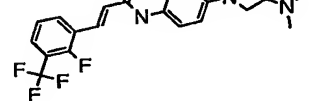
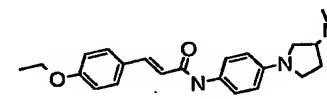
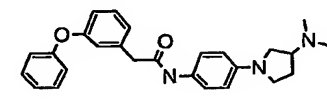
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
778		C <sub>21</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	379,20	380
779		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,21	414
780		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O	410,21	411
781		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O	417,25	418
782		C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> N <sub>6</sub> OS	408,17	409
783		C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O	375,21	376
784		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O	459,23	460
785		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>6</sub> O	430,25	431
786		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>6</sub> O	444,26	445

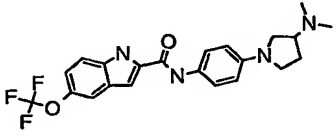
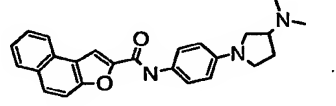
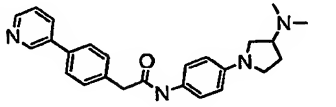
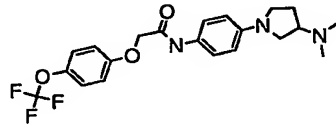
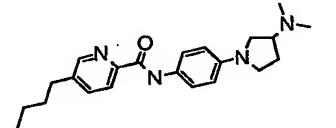
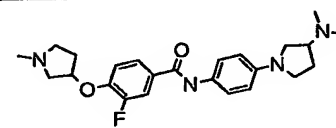
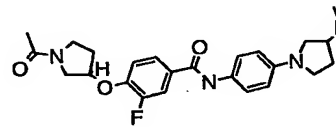
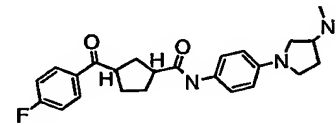
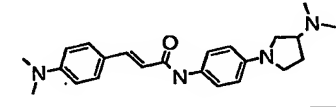
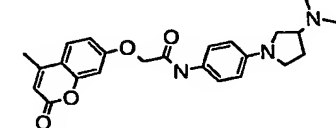
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
787		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> OS	417,19	418
788		C <sub>30</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	466,27	467
789		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> OS	422,21	423
790		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S <sub>2</sub>	503,11	504
791		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	459,11	460
792		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	423,17	424
793		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> OS	406,18	407
794		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	449,18	450
795		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> ClN <sub>4</sub> OS	440,14	441
796		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	391,19	392
797		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	444,18	445

APD62429PC

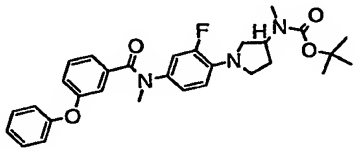
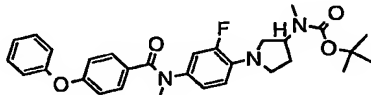
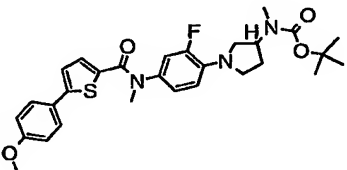
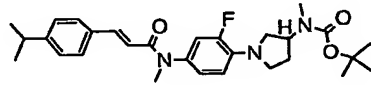
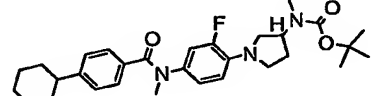
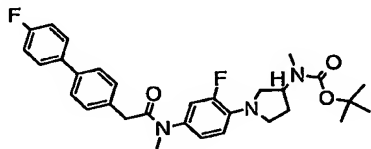
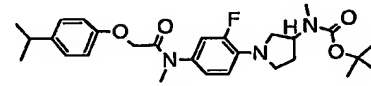
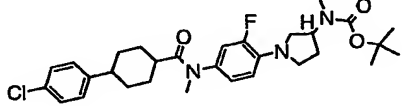
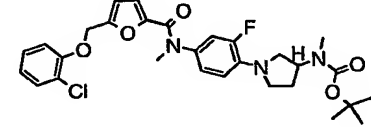
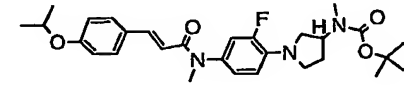
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
798		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	408,22	409
799		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O	402,24	403
800		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,23	416
801		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O	439,24	440
802		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	419,18	420
803		C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	379,19	380
804		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O	360,20	361
805		C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> F <sub>4</sub> N <sub>3</sub> O	421,18	422
806		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	379,23	380
807		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,23	416
808		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O	431,24	432

APD62429PC

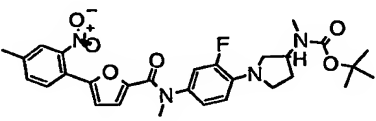
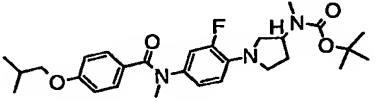
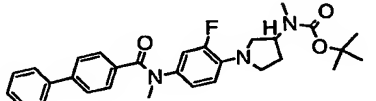
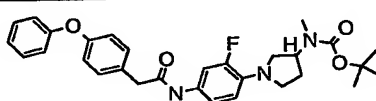
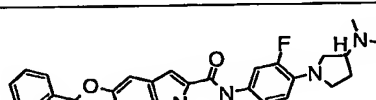
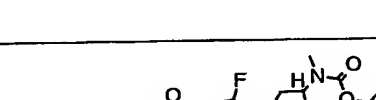
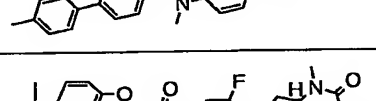
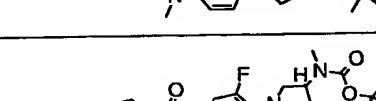
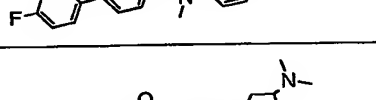
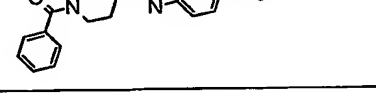
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
809		C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	432,18	433
810		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,20	400
811		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O	400,23	401
812		C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	423,18	424
813		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O	366,24	367
814		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	426,24	427
815		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	454,24	455
816		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	423,23	424
817		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O	378,24	379
818		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	421,20	422



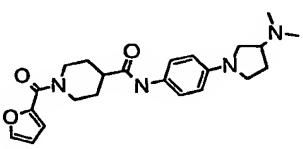
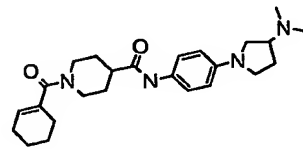
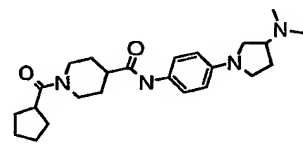
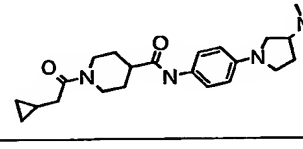
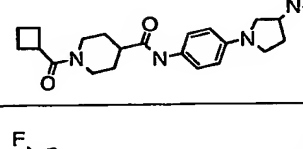
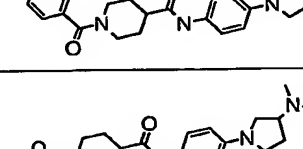
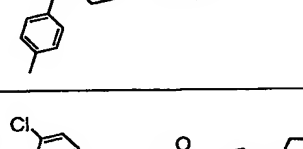
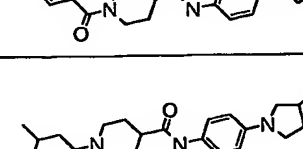
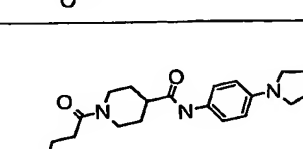
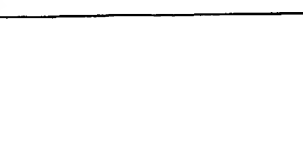
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
819		C <sub>30</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	519,25	520
820		C <sub>30</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	519,25	520
821		C <sub>29</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S	539,22	540
822		C <sub>29</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	495,29	496
823		C <sub>30</sub> H <sub>40</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	509,30	510
824		C <sub>31</sub> H <sub>35</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	535,27	536
825		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	499,29	500
826		C <sub>30</sub> H <sub>39</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	543,27	544
827		C <sub>29</sub> H <sub>33</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>5</sub>	557,21	558
828		C <sub>29</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	511,29	512

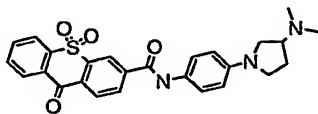
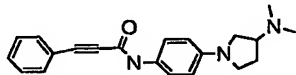
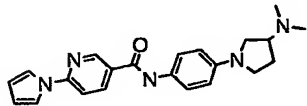
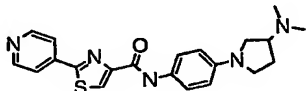
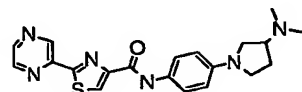
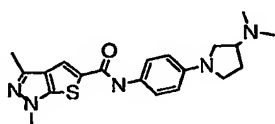
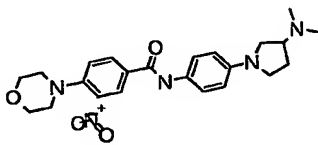
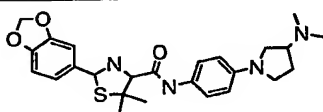
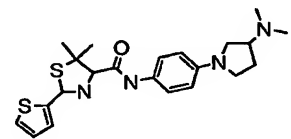
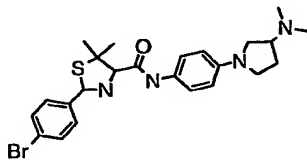
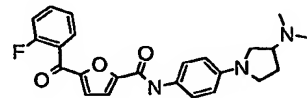
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
829		C <sub>29</sub> H <sub>33</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>6</sub>	552,24	553
830		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	499,29	500
831		C <sub>30</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	503,26	504
832		C <sub>31</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	533,27	534
833		C <sub>33</sub> H <sub>37</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	572,28	573
834		C <sub>31</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	517,27	518
835		C <sub>29</sub> H <sub>40</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	513,30	514
836		C <sub>30</sub> H <sub>33</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	521,25	522
837		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	420,25	421
838		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	426,21	427

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
839		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	410,23	411
840		C <sub>25</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	424,28	425
841		C <sub>24</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	412,28	413
842		C <sub>23</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	398,27	399
843		C <sub>23</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	398,27	399
844		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	438,24	439
845		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,27	435
846		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	454,21	455
847		C <sub>23</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	400,28	401
848		C <sub>23</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	400,28	401

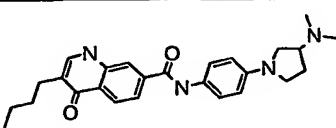
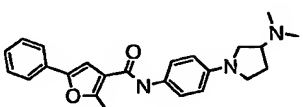
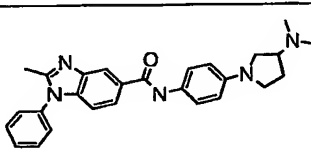
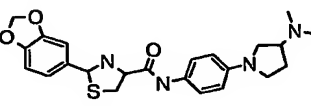
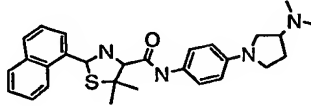
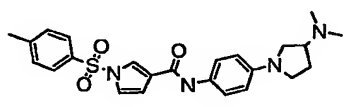
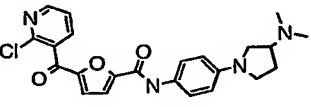
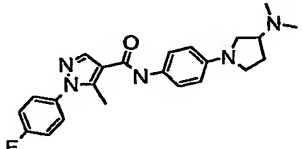
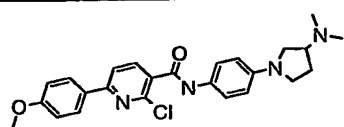
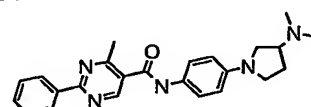
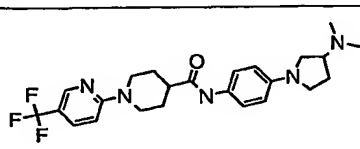
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
849		C <sub>26</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S	475,16	476
850		C <sub>21</sub> H <sub>23</sub> N <sub>3</sub> O	333,18	334
851		C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O	375,21	376
852		C <sub>21</sub> H <sub>23</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub> S	393,16	394
853		C <sub>20</sub> H <sub>22</sub> N <sub>6</sub> O <sub>2</sub> S	394,16	395
854		C <sub>20</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub> S	383,18	384
855		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub>	439,22	440
856		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	468,22	469
857		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>	430,19	431
858		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> BrN <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	502,14	503
859		C <sub>24</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	421,18	422

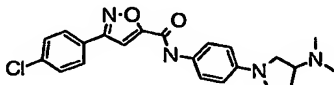
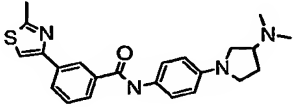
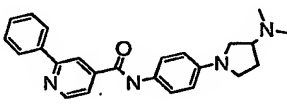
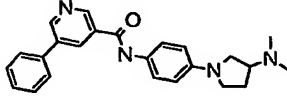
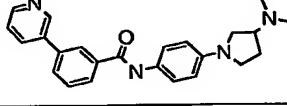
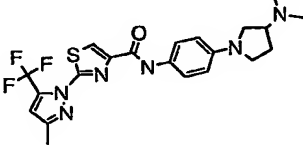
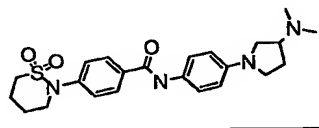
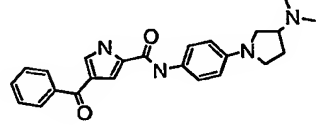
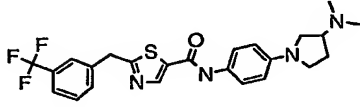
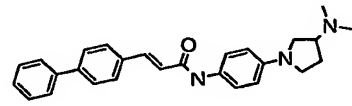
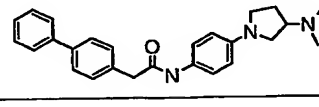
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
860		C <sub>28</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O	470,19	471
861		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> OS	425,23	426
862		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>5</sub> S	462,19	463
863		C <sub>23</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> S	460,21	461
864		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O	439,24	440
865		C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	391,20	392
866		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S	479,19	480
867		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> OS	460,15	461
868		C <sub>22</sub> H <sub>29</sub> N <sub>7</sub> O <sub>2</sub>	423,24	424
869		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> N <sub>6</sub> O	426,22	427

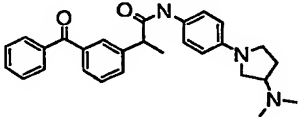
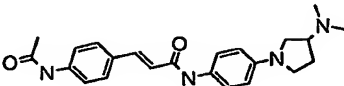
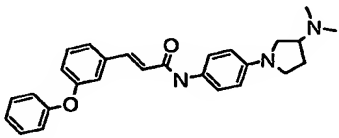
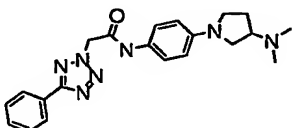
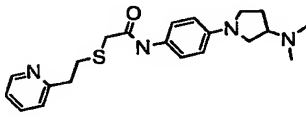
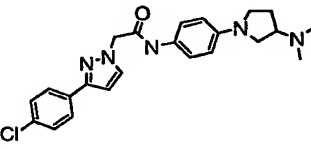
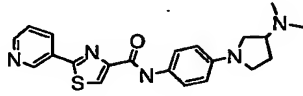
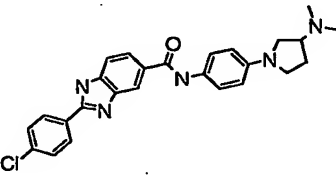
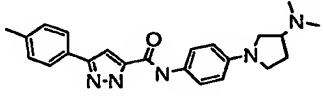
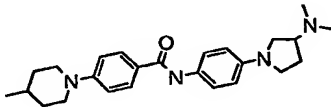
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
870		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	432,25	433
871		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	389,21	390
872		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O	439,24	440
873		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	440,19	441
874		C <sub>28</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> OS	474,24	475
875		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	452,19	453
876		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	438,15	439
877		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>5</sub> O	407,21	408
878		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	450,18	451
879		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O	401,22	402
880		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O	461,24	462

APD62429PC

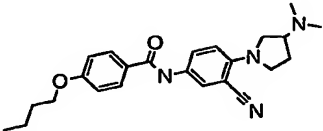
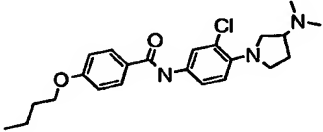
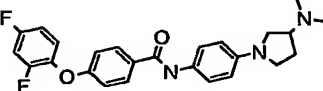
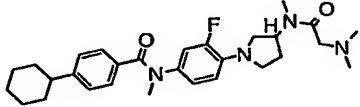
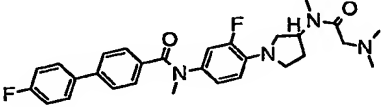
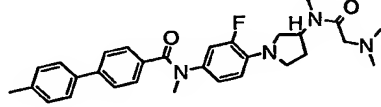
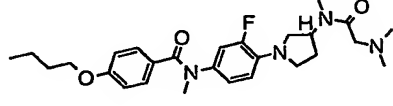
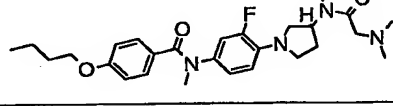
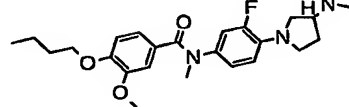
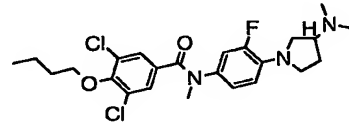
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
881		C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	410,15	411
882		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> OS	406,18	407
883		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O	386,21	387
884		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O	386,21	387
885		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O	386,21	387
886		C <sub>21</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>6</sub> OS	464,16	465
887		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	442,20	443
888		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	402,21	403
889		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> OS	474,17	475
890		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O	411,23	412
891		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O	399,23	400

APD62429PC

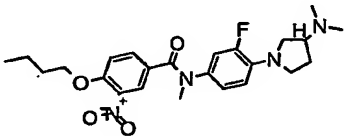
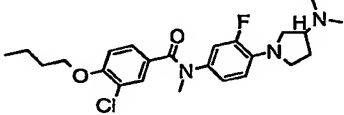
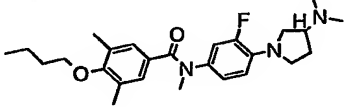
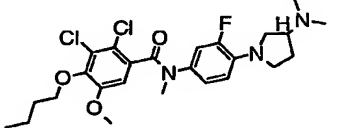
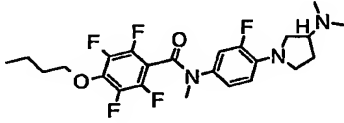
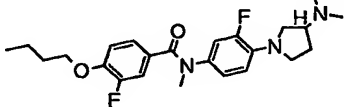
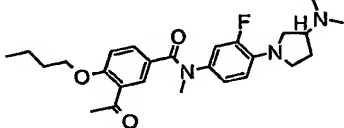
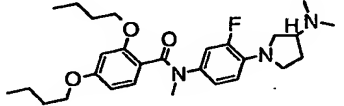
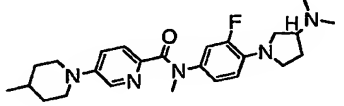
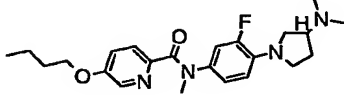
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
892		C <sub>28</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	441,24	442
893		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	392,22	393
894		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,23	428
895		C <sub>21</sub> H <sub>25</sub> N <sub>7</sub> O	391,21	392
896		C <sub>21</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> OS	384,20	385
897		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>5</sub> O	423,18	424
898		C <sub>21</sub> H <sub>23</sub> N <sub>5</sub> OS	393,16	394
899		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>5</sub> O	459,18	460
900		C <sub>23</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O	389,22	390
901		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	406,27	407



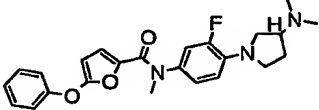
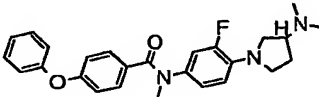
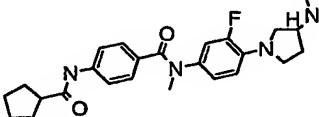
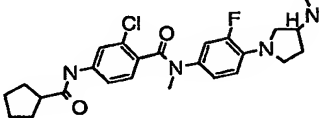
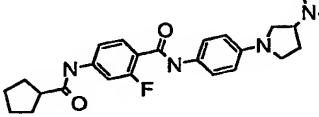
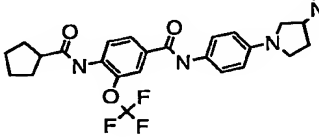
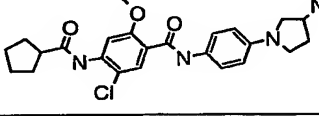
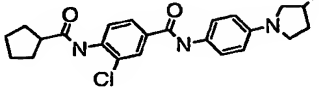
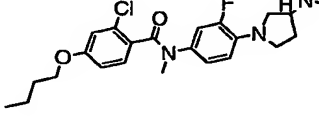
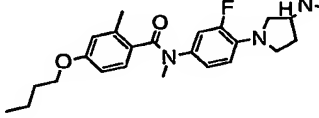
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
902		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	406,24	407
903		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,20	416
904		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	437,19	438
905		C <sub>29</sub> H <sub>39</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	494,31	495
906		C <sub>29</sub> H <sub>32</sub> F <sub>2</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	506,25	507
907		C <sub>30</sub> H <sub>35</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	502,27	503
908		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	484,29	485
909		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	484,29	485
910		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,26	444
911		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> Cl <sub>2</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	481,17	482

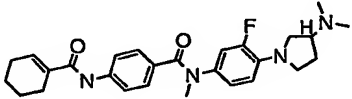
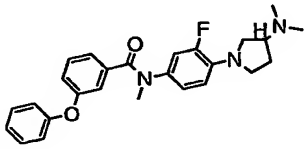
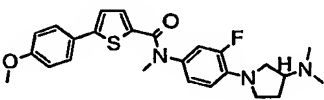
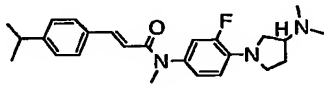
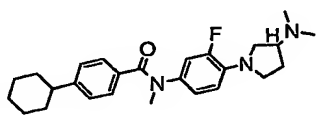
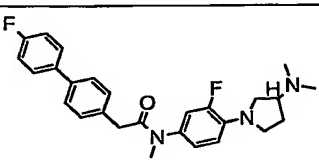
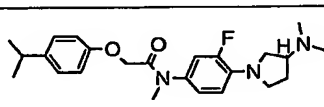
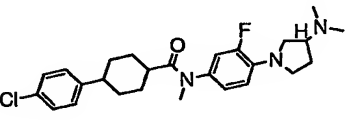
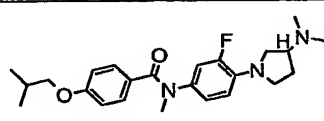
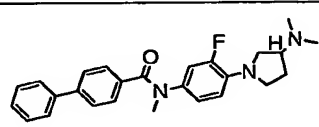
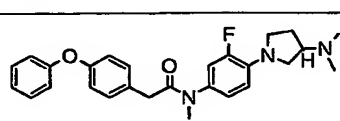
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
912		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	458,23	459
913		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	447,21	448
914		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	441,28	442
915		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> Cl <sub>2</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	511,18	512
916		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> F <sub>5</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	485,21	486
917		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	431,24	432
918		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	455,26	456
919		C <sub>28</sub> H <sub>40</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	485,30	486
920		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>5</sub> O	439,27	440
921		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	414,24	415

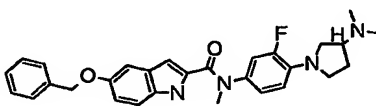
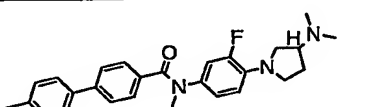
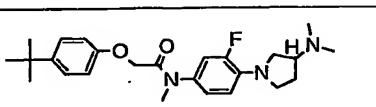
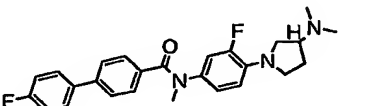
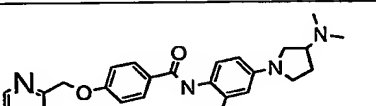
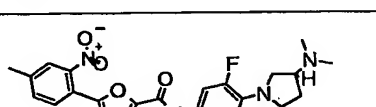
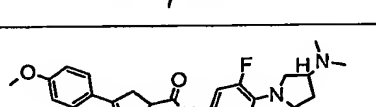
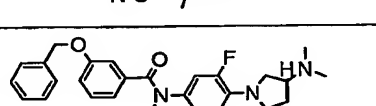
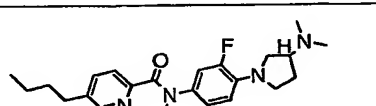
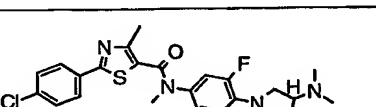
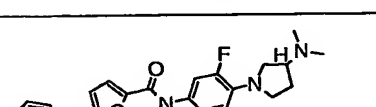
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
922		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	423,20	424
923		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	433,22	434
924		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	452,26	453
925		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> ClFN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	486,22	487
926		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	438,24	439
927		C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	504,23	505
928		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	484,22	485
929		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	454,21	455
930		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	447,21	448
931		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,26	428

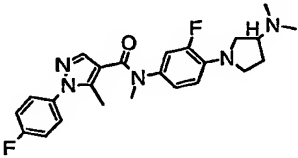
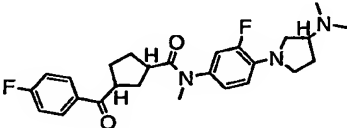
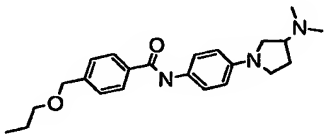
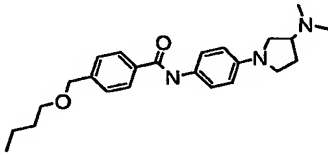
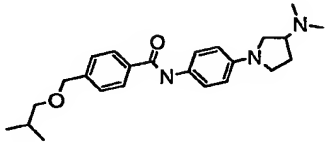
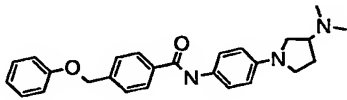
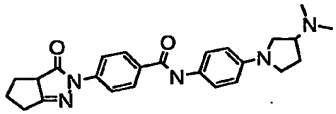
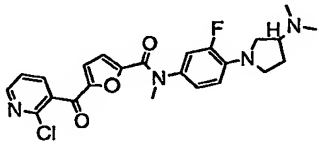
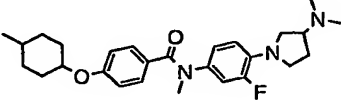
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
932		C <sub>27</sub> H <sub>33</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	464,26	465
933		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	433,22	434
934		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	453,19	454
935		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O	409,25	410
936		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O	423,27	424
937		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	449,23	450
938		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,25	414
939		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> ClFN <sub>3</sub> O	457,23	458
940		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,25	414
941		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O	417,22	418
942		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	447,23	448

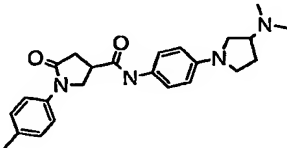
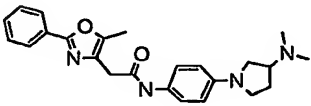
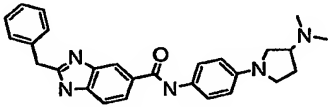
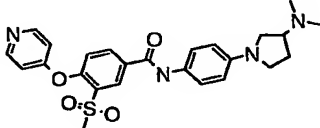
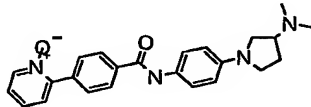
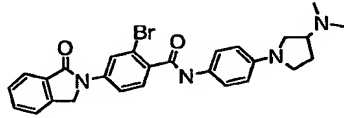
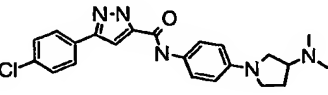
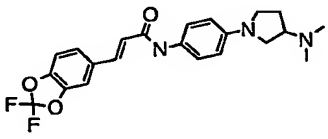
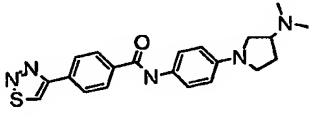
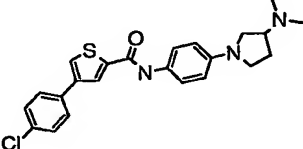
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
943		C <sub>29</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	486,24	487
944		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O	431,24	432
945		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,26	428
946		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	435,21	436
947		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,52	435
948		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	466,20	467
949		C <sub>24</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	440,22	441
950		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	447,23	448
951		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O	398,25	399
952		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> ClFN <sub>4</sub> OS	472,15	473
953		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	453,19	454

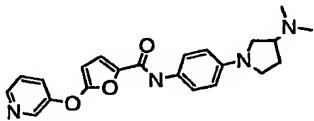
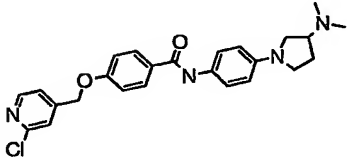
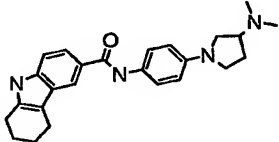
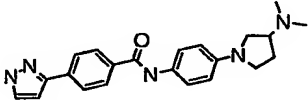
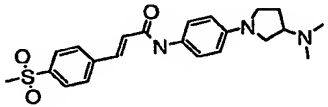
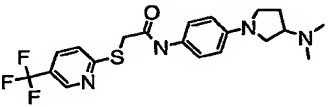
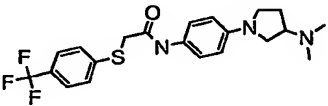
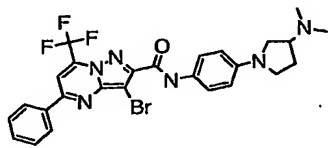
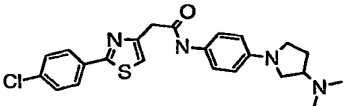
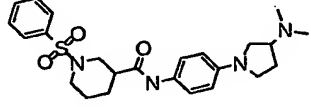
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
954		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> F <sub>2</sub> N <sub>5</sub> O	439,22	440
955		C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	455,24	456
956		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	381,24	382
957		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	395,26	396
958		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	395,26	396
959		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,23	416
960		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	431,23	432
961		C <sub>24</sub> H <sub>24</sub> ClFN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	470,15	471
962		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	453,61	454

APD62429PC

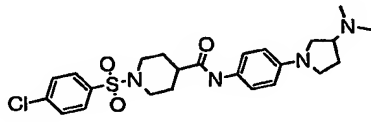
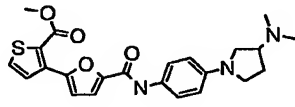
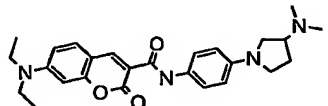
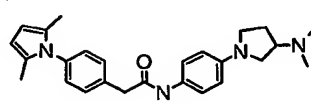
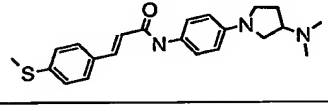
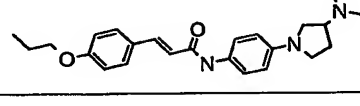
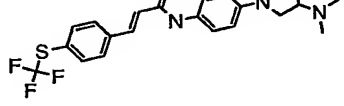
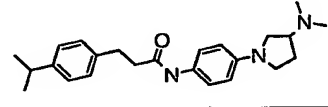
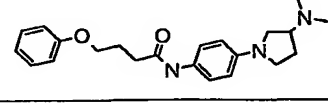
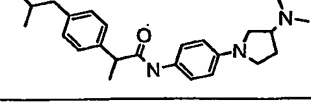
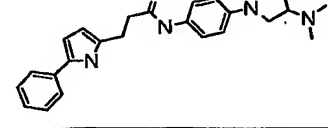
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
963		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	406,24	407
964		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	404,22	405
965		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O	439,24	440
966		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> S	480,18	481
967		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	402,21	403
968		C <sub>27</sub> H <sub>27</sub> BrN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	518,13	519
969		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> ClN <sub>5</sub> O	409,17	410
970		C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	415,17	416
971		C <sub>21</sub> H <sub>23</sub> N <sub>5</sub> OS	393,16	394
972		C <sub>23</sub> H <sub>24</sub> ClN <sub>3</sub> OS	425,13	426

APD62429PC

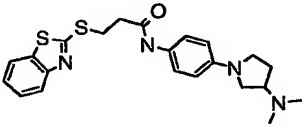
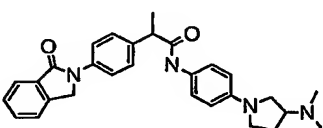
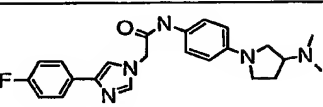
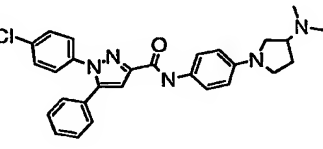
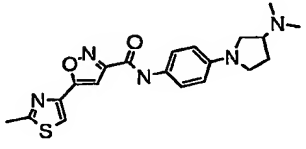
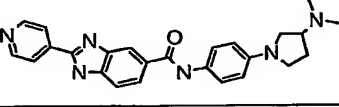
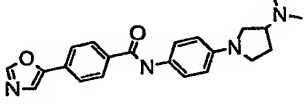
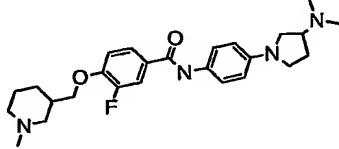
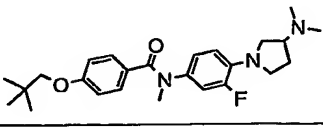
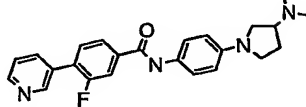
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
973		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	392,18	393
974		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	450,18	451
975		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O	402,24	403
976		C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O	375,21	376
977		C <sub>22</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	413,18	414
978		C <sub>20</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> OS	424,15	425
979		C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> OS	423,16	424
980		C <sub>26</sub> H <sub>24</sub> BrF <sub>3</sub> N <sub>6</sub> O	572,11	573
981		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> ClN <sub>4</sub> OS	440,14	441
982		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	456,22	457



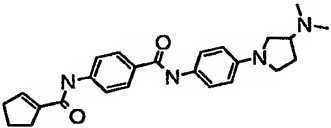
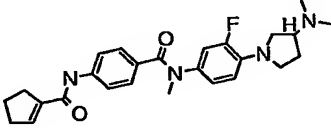
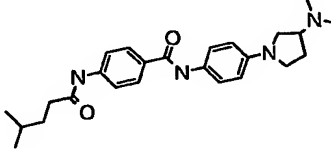
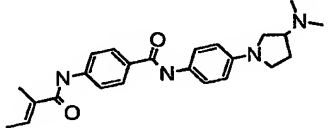
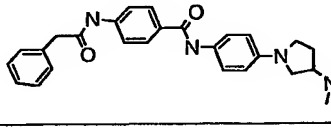
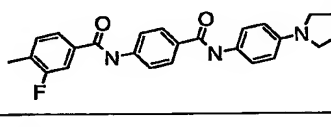
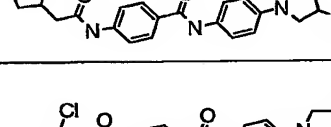
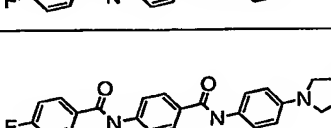
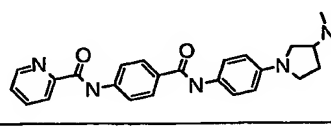

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
983		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	490,18	491
984		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S	439,16	440
985		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	448,25	449
986		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O	416,26	417
987		C <sub>22</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> OS	381,19	382
988		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	393,24	394
989		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> OS	435,16	436
990		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O	379,26	380
991		C <sub>22</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	367,23	368
992		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O	393,28	394
993		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O	402,24	403

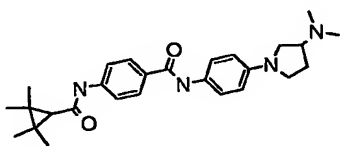
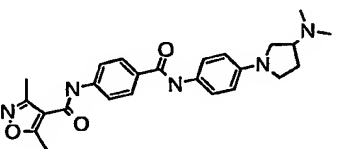
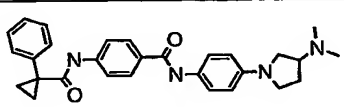
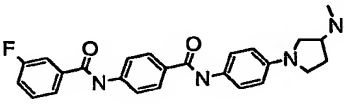
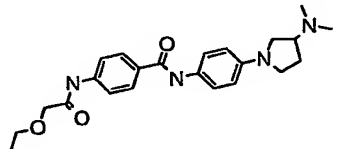
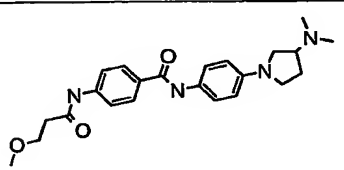
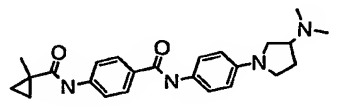
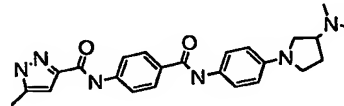
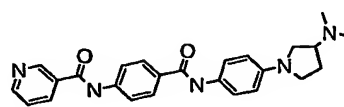
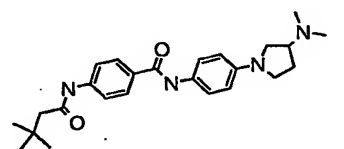
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
994		C <sub>22</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> OS <sub>2</sub>	426,15	427
995		C <sub>29</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	468,25	469
996		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>5</sub> O	407,21	408
997		C <sub>28</sub> H <sub>28</sub> ClN <sub>5</sub> O	485,20	486
998		C <sub>20</sub> H <sub>23</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub> S	397,16	398
999		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> N <sub>6</sub> O	426,22	427
1000		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	376,19	377
1001		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	454,27	455
1002		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,57	428
1003		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O	404,20	405

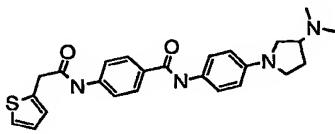
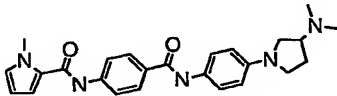
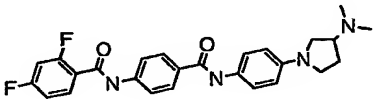
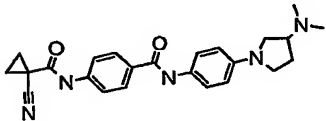
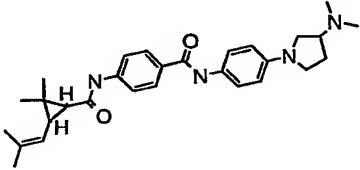
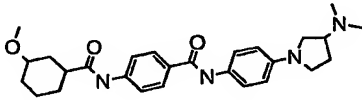
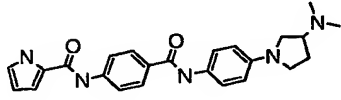
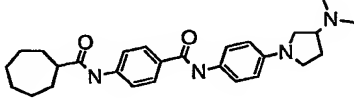
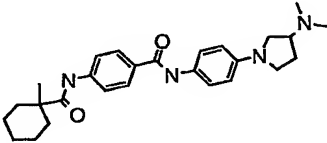
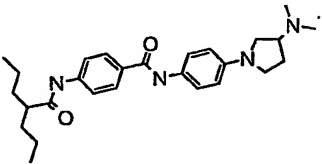
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1004		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	418,24	419
1005		C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	450,24	451
1006		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	422,27	423
1007		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	406,24	407
1008		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,24	443
1009		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	460,23	461
1010		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,27	435
1011		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> ClFN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	480,17	481
1012		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	446,21	447
1013		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	429,22	430

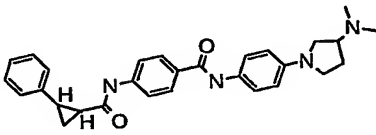
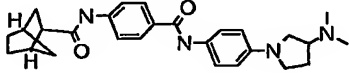
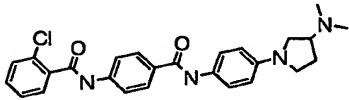
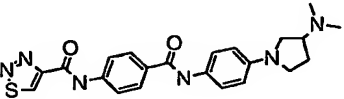
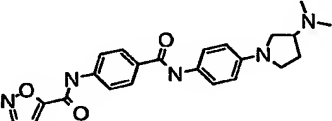
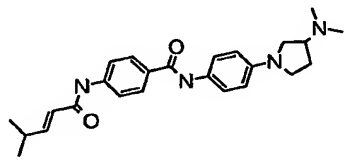
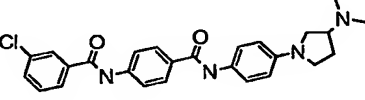
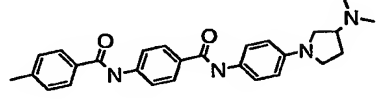
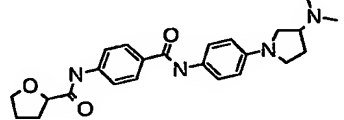
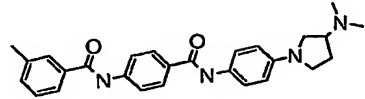
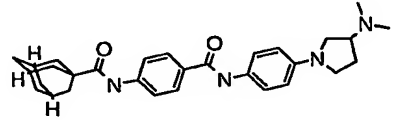
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1014		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	448,28	449
1015		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	447,23	448
1016		C <sub>29</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	468,25	469
1017		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	446,21	447
1018		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	410,23	411
1019		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	410,23	411
1020		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	406,24	407
1021		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	432,23	433
1022		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	429,22	430
1023		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	422,27	423

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1024		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	448,19	449
1025		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	431,23	432
1026		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> F <sub>2</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	464,20	465
1027		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	417,22	418
1028		C <sub>29</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	474,30	475
1029		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	464,28	465
1030		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	417,22	418
1031		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	448,28	449
1032		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	448,28	449
1033		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	450,30	451

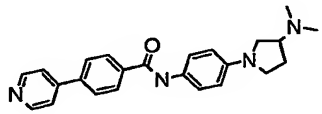
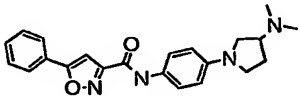
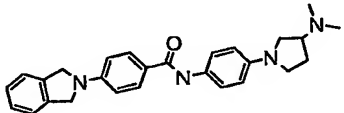
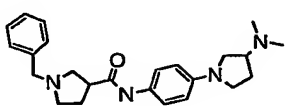
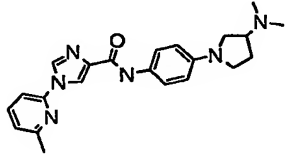
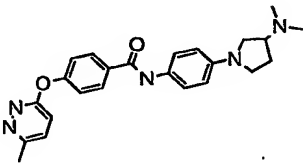
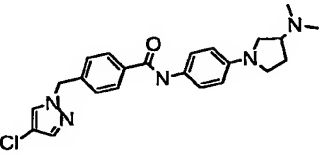
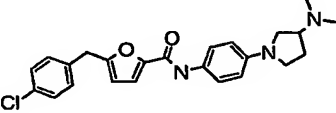
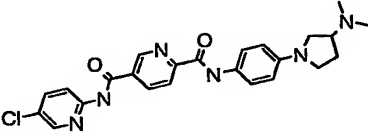
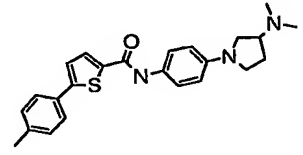
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1034		C <sub>29</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	468,25	469
1035		C <sub>27</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	446,27	447
1036		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	462,18	463
1037		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> N <sub>6</sub> O <sub>2</sub> S	436,17	437
1038		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	419,20	420
1039		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	420,25	421
1040		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	462,18	463
1041		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,24	443
1042		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	422,23	423
1043		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,24	443
1044		C <sub>30</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	486,30	487

APD62429PC

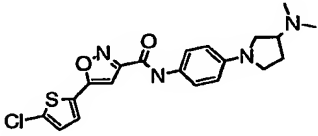
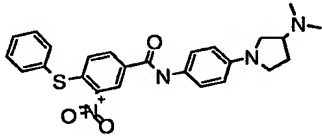
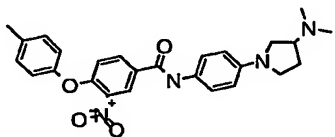
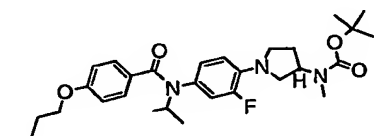
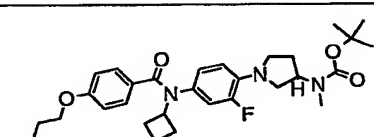
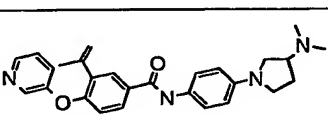
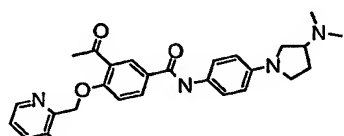
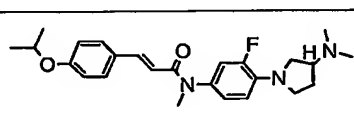
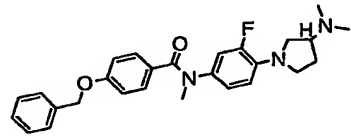
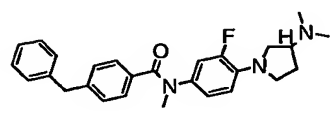
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1045		C <sub>29</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	486,26	487
1046		C <sub>27</sub> H <sub>28</sub> F <sub>2</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	494,21	495
1047		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	436,25	437
1048		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	448,28	449
1049		C <sub>23</sub> H <sub>27</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	448,21	449
1050		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	432,25	433
1051		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	436,28	437
1052		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	385,22	386
1053		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,24	443
1054		C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> N <sub>6</sub> O	376,20	377
1055		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>S</sub>	445,19	446

APD62429PC

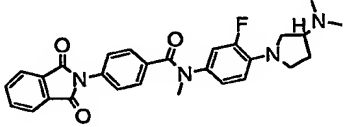
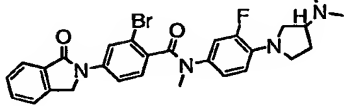
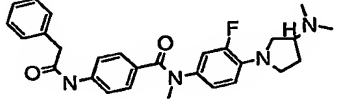
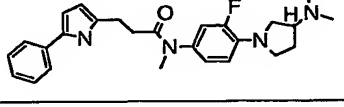
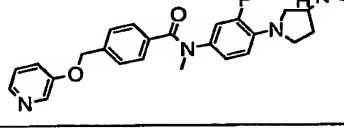
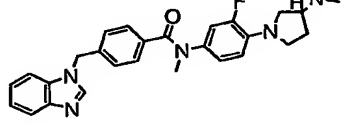
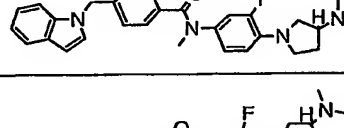
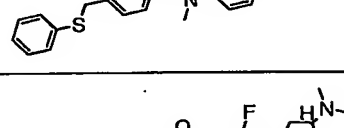
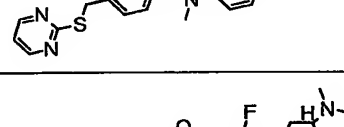

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1056		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O	386,21	387
1057		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	376,19	377
1058		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O	426,24	427
1059		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O	392,26	393
1060		C <sub>22</sub> H <sub>26</sub> N <sub>6</sub> O	390,22	391
1061		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	417,22	418
1062		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>5</sub> O	423,18	424
1063		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	423,17	424
1064		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> ClN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	464,17	465
1065		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> OS	405,19	406



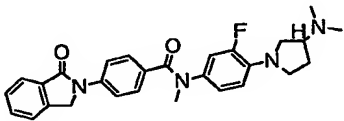
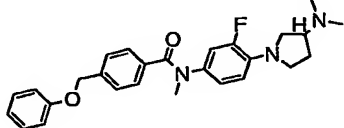
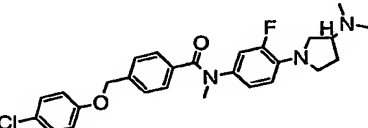
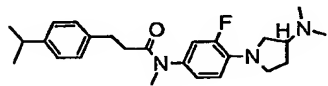
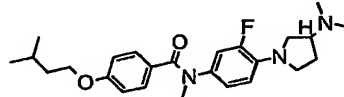
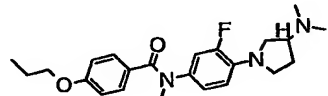
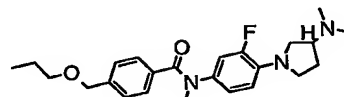
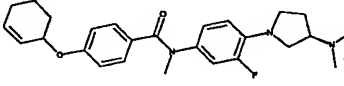
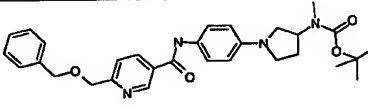
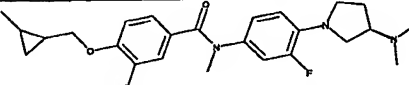
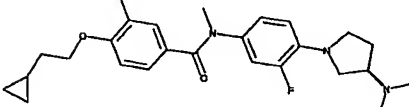
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1066		C <sub>20</sub> H <sub>21</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	416,11	417
1067		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	462,17	463
1068		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	460,21	461
1069		C <sub>30</sub> H <sub>42</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	527,32	528
1070		C <sub>31</sub> H <sub>42</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	539,32	540
1071		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,24	443
1072		C <sub>28</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	472,25	473
1073		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	425,25	426
1074		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	447,23	448
1075		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O	431,24	432

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1076		C <sub>28</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	486,21	487
1077		C <sub>28</sub> H <sub>28</sub> BrFN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	550,14	551
1078		C <sub>28</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	474,24	475
1079		C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O	434,25	435
1080		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	448,23	449
1081		C <sub>28</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>5</sub> O	471,24	472
1082		C <sub>29</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O	470,25	471
1083		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> OS	463,21	464
1084		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>5</sub> OS	465,20	466
1085		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> OS	464,20	465

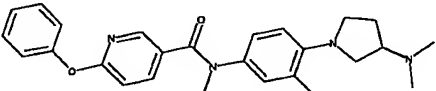
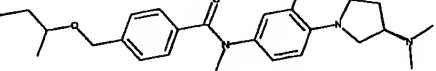
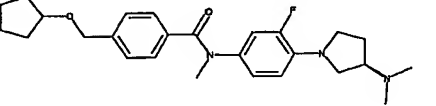
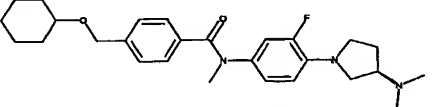
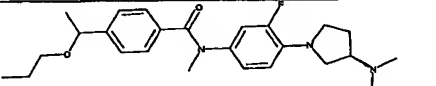
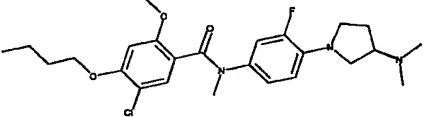
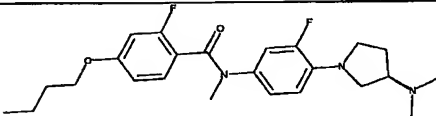
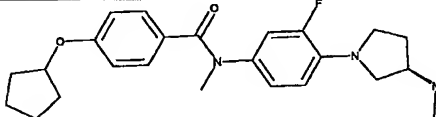
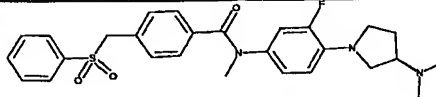
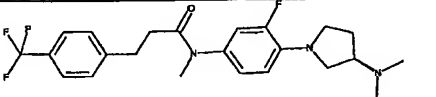
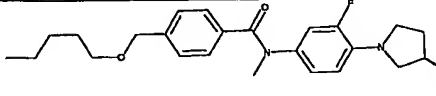
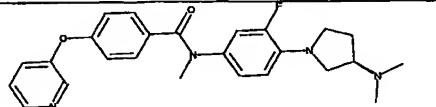
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1086		C <sub>28</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	472,23	473
1087		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	447,23	448
1088		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	481,19	482
1089		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O	411,27	412
1090		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,26	428
1091		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,23	400
1092		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,25	414
1093		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	437,25	438
1094		C <sub>30</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	516,27	517
1095		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	443,24	444
1096		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	443,24	444

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1097		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	451,21	452
1098		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> F <sub>2</sub> N <sub>4</sub> O	456,27	457
1099		C <sub>27</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	458,21	459
1100		C <sub>27</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	458,21	459
1101		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	411,23	412
1102		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> OS	424,17	425
1103		C <sub>28</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	472,23	473
1104		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	425,25	426
1105		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> OS	438,19	439
1106		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,26	444
1107		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	451,21	452
1108		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	453,28	454
1109		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	469,20	470

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1110		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,21	435
1111		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,26	428
1112		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	439,26	440
1113		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	453,28	454
1114		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,26	428
1115		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	477,22	478
1116		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	431,24	432
1117		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	425,25	426
1118		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	495,62	496
1119		C <sub>23</sub> H <sub>27</sub> F <sub>4</sub> N <sub>3</sub> O	437,21	438
1120		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	441,28	442
1121		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	434,21	435

APD62429PC

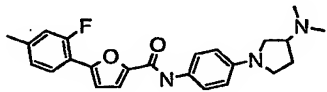
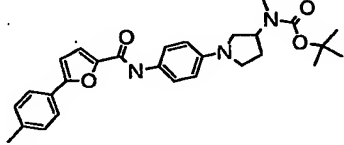
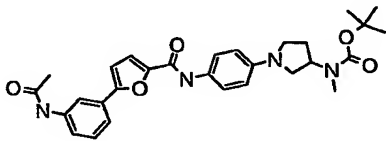
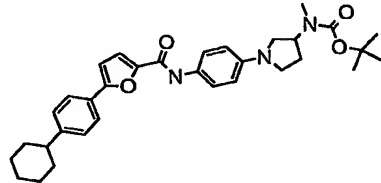
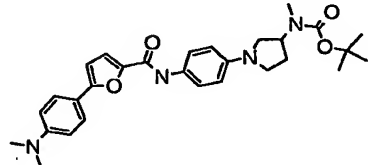
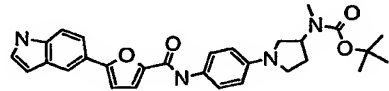
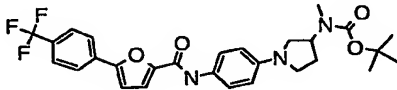
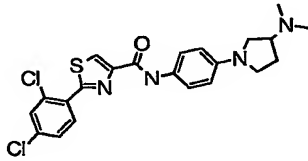
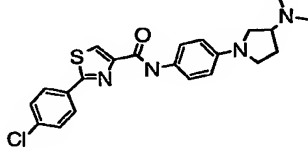
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1122		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	407,26	408
1123		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	393,24	394
1124		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,26	428
1125		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,23	400
1126		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	481,19	482
1127		C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> F <sub>4</sub> N <sub>3</sub> OS	455,17	456
1128		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	425,25	426
1129		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> F <sub>2</sub> N <sub>4</sub> O	442,25	443
1130		C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	448,23	449

5

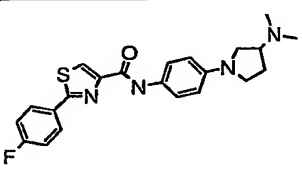
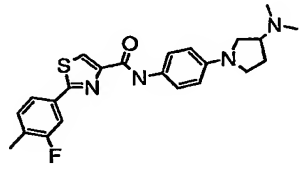
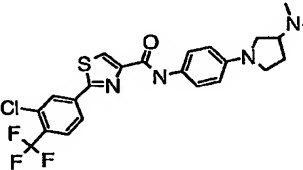
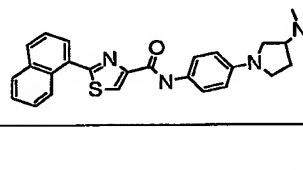
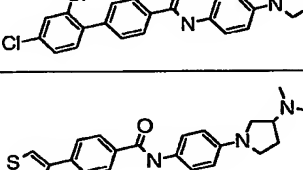
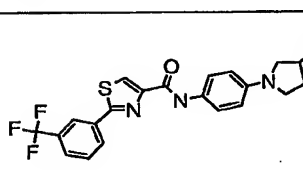
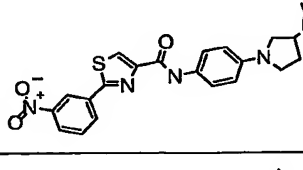
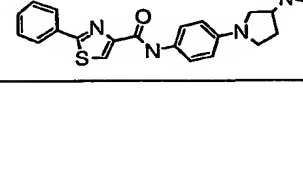

Tabelle 8

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1131		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	443,12	444
1132		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,15	428

APD62429PC

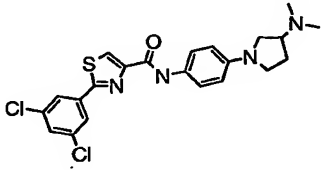
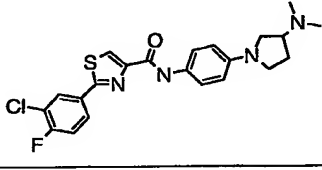
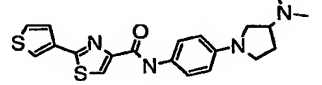
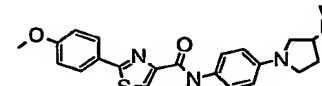
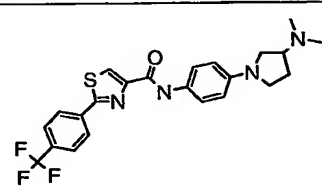
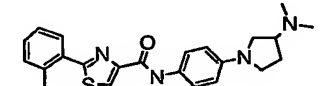
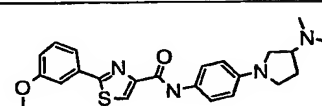
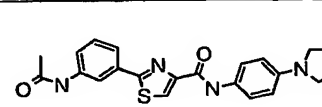
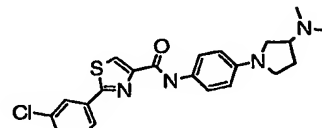
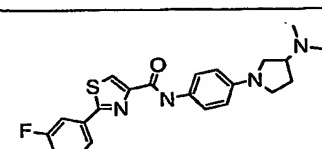
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1133		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	407,20	408
1134		C <sub>28</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	475,25	476
1135		C <sub>29</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>5</sub>	518,25	519
1136		C <sub>33</sub> H <sub>41</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	543,31	544
1137		C <sub>29</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	504,27	505
1138		C <sub>29</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	500,24	501
1139		C <sub>28</sub> H <sub>30</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	529,22	530
1140		C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>4</sub> OS	460,09	461
1141		C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> ClN <sub>4</sub> OS	426,13	427

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1142		C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> OS	410,16	411
1143		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> OS	424,17	425
1144		C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> ClF <sub>3</sub> N <sub>4</sub> OS	494,12	495
1145		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> OS	442,18	443
1146		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	453,14	454
1147		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> OS	391,17	392
1148		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> OS	460,15	461
1149		C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> S	437,15	438
1150		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> OS	392,17	393



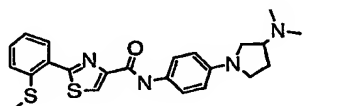
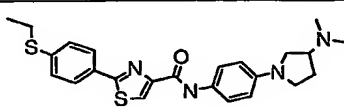
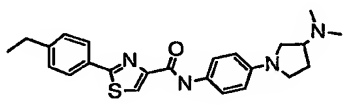
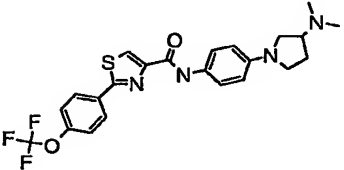
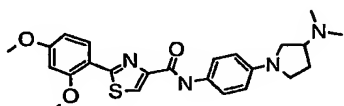
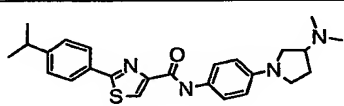
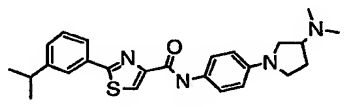
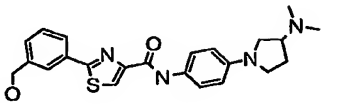
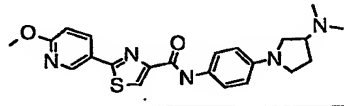
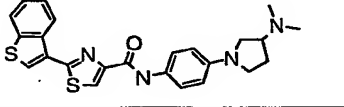
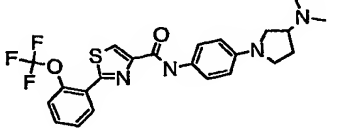
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1151		C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>4</sub> OS	460,09	461
1152		C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> ClFN <sub>4</sub> OS	444,12	445
1153		C <sub>20</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> OS <sub>2</sub>	398,12	399
1154		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	422,18	423
1155		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> OS	460,15	461
1156		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> OS	406,18	407
1157		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	422,18	423
1158		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub> S	449,19	450
1159		C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> ClN <sub>4</sub> OS	426,13	427
1160		C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> OS	410,16	411

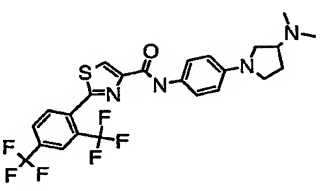
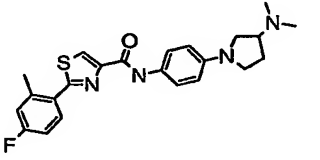
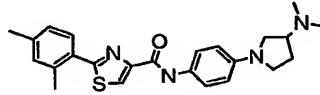
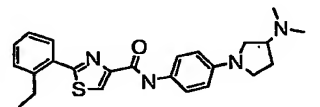
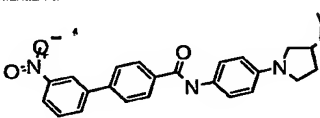
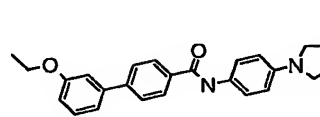
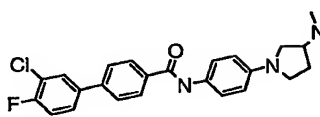
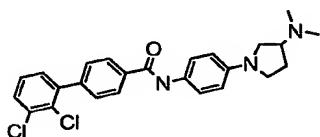
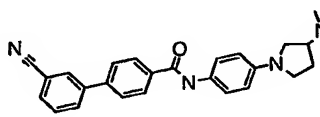
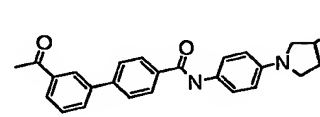
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1161		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> OS	442,18	443
1162		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> OS <sub>2</sub>	438,15	439
1163		C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>4</sub> OS	460,09	461
1164		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	436,19	437
1165		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	436,19	437
1166		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> OS	448,23	449
1167		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> N <sub>5</sub> OS	417,16	418
1168		C <sub>28</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> OS	468,20	469
1169		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	436,19	437
1170		C <sub>23</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	436,16	437
1171		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	464,23	465

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1172		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	438,15	439
1173		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	452,17	453
1174		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	452,17	453
1175		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	476,15	477
1176		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	452,19	453
1177		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	434,21	435
1178		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	434,21	435
1179		C <sub>23</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	422,18	423
1180		C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub> S	423,17	424
1181		C <sub>24</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	448,14	449
1182		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	476,15	477

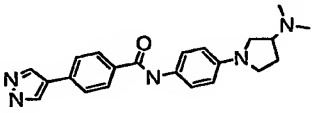
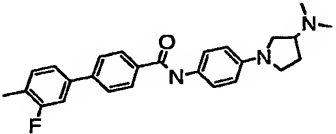
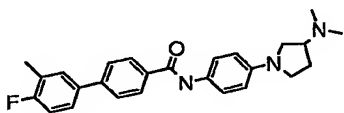
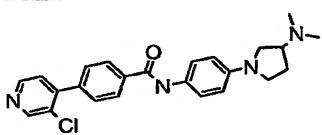
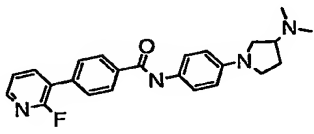
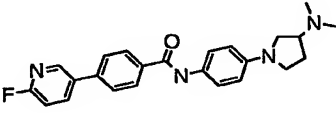
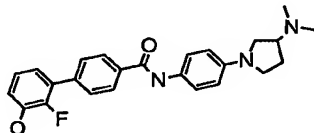
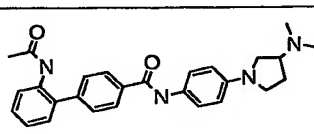
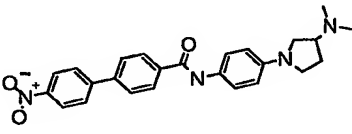
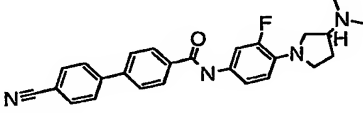
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1183		C <sub>24</sub> H <sub>22</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> OS	528,14	529
1184		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> OS	424,17	425
1185		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> OS	420,20	421
1186		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> OS	420,20	421
1187		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	430,20	431
1188		C <sub>27</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	429,24	430
1189		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> ClFN <sub>3</sub> O	437,17	438
1190		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	453,14	454
1191		C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O	410,21	411
1192		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,23	428

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1193		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,23	428
1194		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	421,20	422
1195		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	421,20	422
1196		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	444,22	445
1197		C <sub>27</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O	428,26	429
1198		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	416,22	417
1199		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,22	444
1200		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	404,22	405
1201		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	375,20	376
1202		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O	404,20	405

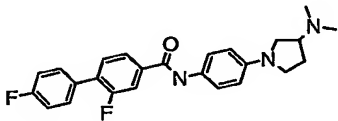
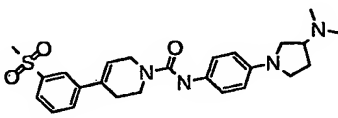
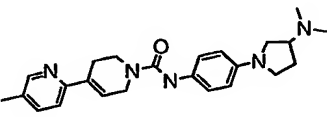
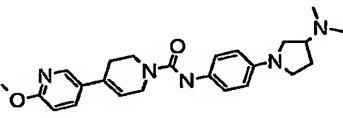
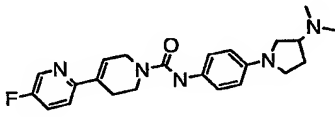
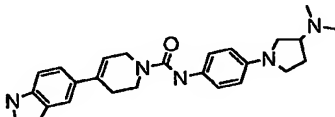
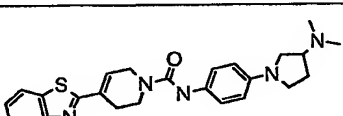
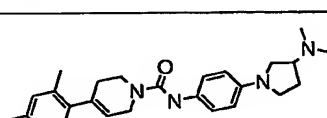
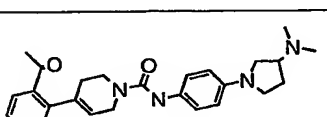
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1203		C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O	375,21	376
1204		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O	417,22	418
1205		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O	417,22	418
1206		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> ClN <sub>4</sub> O	420,17	421
1207		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O	404,20	405
1208		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O	404,20	405
1209		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	433,22	434
1210		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	442,24	443
1211		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	430,20	431
1212		C <sub>26</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O	428,20	429

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1213		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O	404,20	405
1214		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O	404,20	405
1215		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	481,18	482
1216		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	460,23	461
1217		C <sub>28</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	474,24	475
1218		C <sub>26</sub> H <sub>25</sub> F <sub>4</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	487,19	488
1219		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	481,18	482
1220		C <sub>26</sub> H <sub>25</sub> F <sub>4</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	487,19	488
1221		C <sub>26</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O	428,20	429
1222		C <sub>27</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	460,23	461
1223		C <sub>26</sub> H <sub>25</sub> F <sub>4</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	487,19	488

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1224		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	421,20	422
1225		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	468,22	469
1226		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O	405,25	406
1227		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	421,25	422
1228		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>5</sub> O	409,23	410
1229		C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> N <sub>5</sub> O	429,25	430
1230		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> OS	447,21	448
1231		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O	418,27	419
1232		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	432,25	433

5 Tabelle 9

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
----------	----------	--------------	---------------------------	------------------



APD62429PC

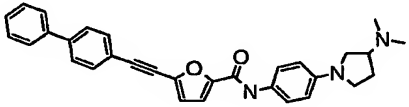
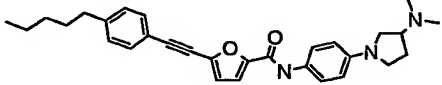
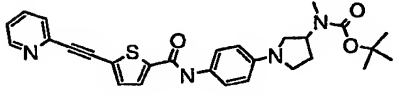
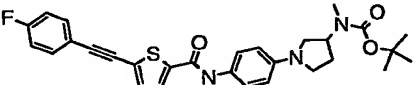
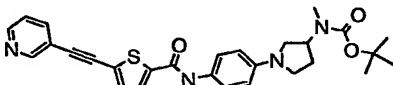
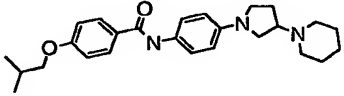
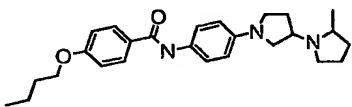
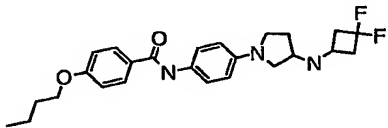
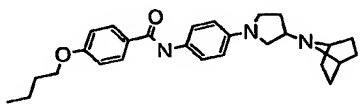
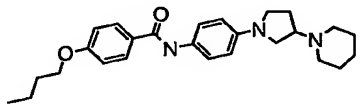
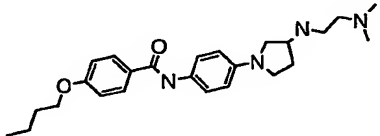
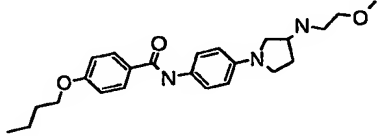
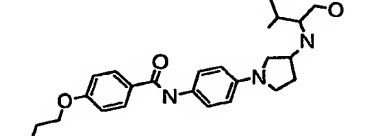
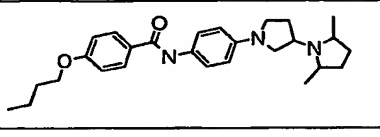
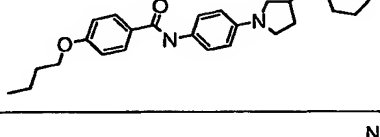
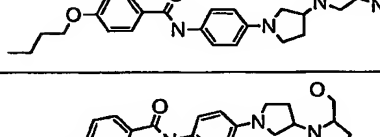
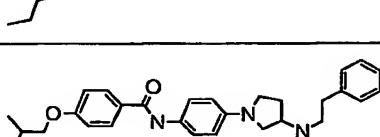
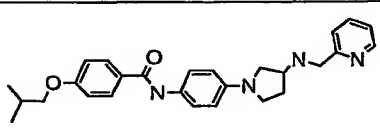
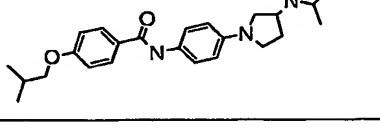

1233		C31H29N3O2	475,23	476
1234		C30H35N3O2	469,27	470
1235		C28H30N4O3S	502,20	503
1236		C29H30FN3O3S	519,20	520
1237		C28H30N4O3S	502,20	503

Tabelle 10

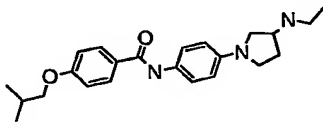
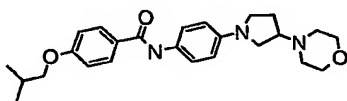
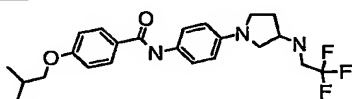
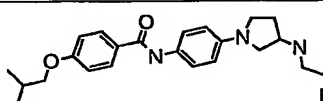
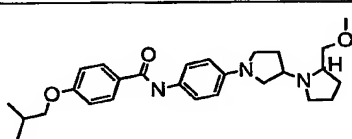
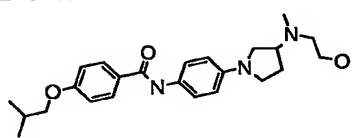
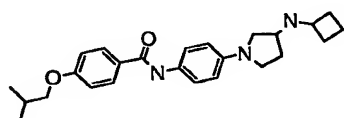
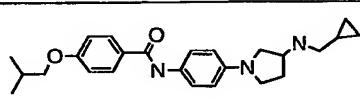
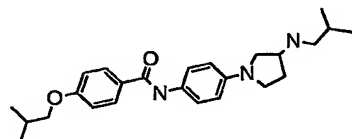
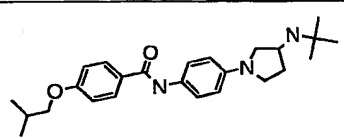
5

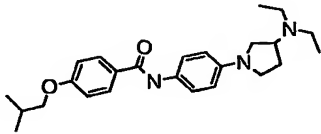
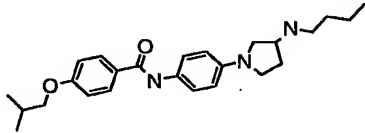
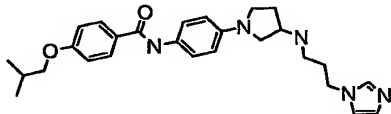
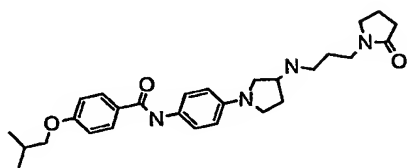
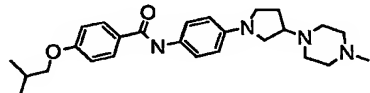
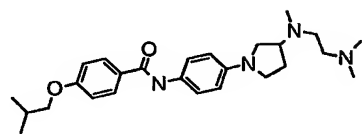
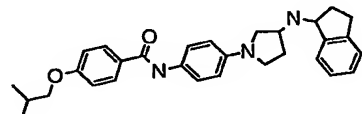
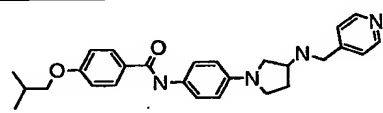
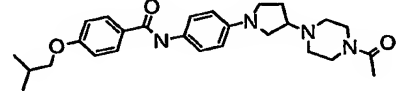
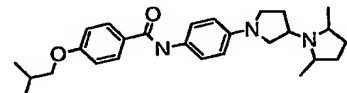
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1238		C26H35N3O2	421,27	422
1239		C26H35N3O2	421,27	422
1240		C25H31F2N3O2	443,24	444
1241		C27H35N3O2	433,27	434
1242		C26H35N3O2	421,27	422

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1243		C <sub>25</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	424,28	425
1244		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	411,25	412
1245		C <sub>26</sub> H <sub>37</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	439,28	440
1246		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	435,29	436
1247		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	435,29	436
1248		C <sub>27</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	459,26	460
1249		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	437,27	438
1250		C <sub>29</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	475,26	476
1251		C <sub>27</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	444,25	445
1252		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	395,26	396

APD62429PC

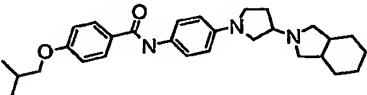
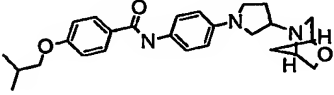
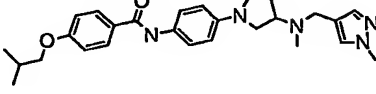
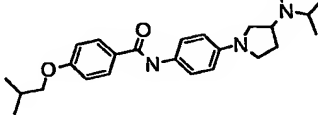
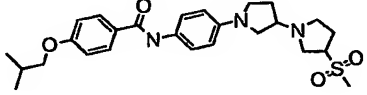
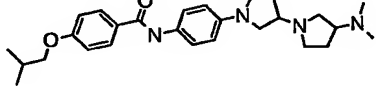
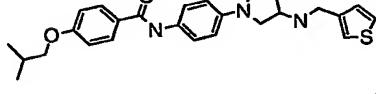
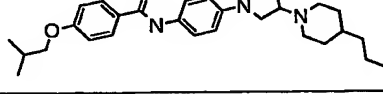
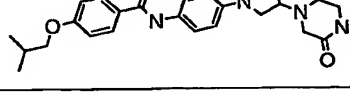
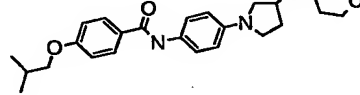
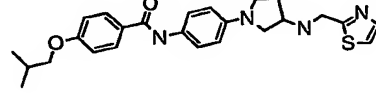
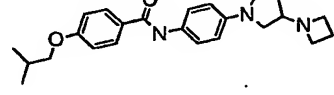
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1253		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	381,24	382
1254		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	423,25	424
1255		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	435,21	436
1256		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,23	400
1257		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	451,28	452
1258		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	411,25	412
1259		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	407,26	408
1260		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	407,26	408
1261		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	409,27	410
1262		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	409,27	410

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1263		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	409,27	410
1264		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	409,27	410
1265		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	461,28	462
1266		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	478,29	479
1267		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	436,28	437
1268		C <sub>26</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	438,30	439
1269		C <sub>30</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	469,27	470
1270		C <sub>27</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	444,25	445
1271		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	464,28	465
1272		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	435,29	436

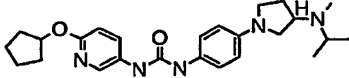
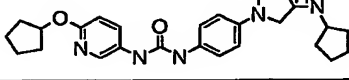
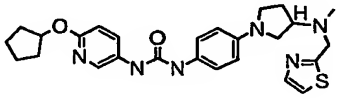
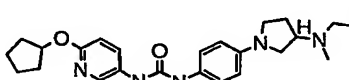
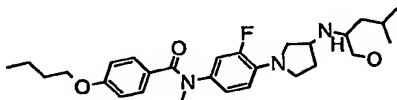
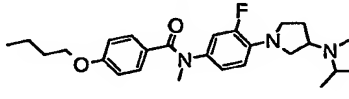
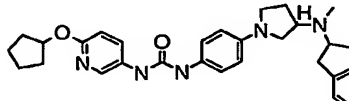
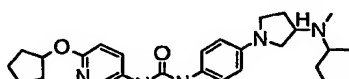
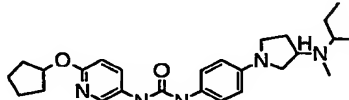
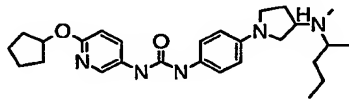
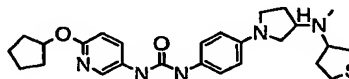
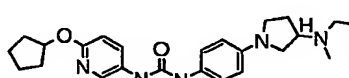
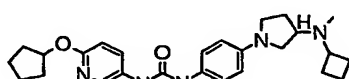
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1273		C <sub>30</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	469,27	470
1274		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	421,27	422
1275		C <sub>29</sub> H <sub>39</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	461,30	462
1276		C <sub>29</sub> H <sub>43</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	465,34	466
1277		C <sub>28</sub> H <sub>39</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	449,30	450
1278		C <sub>28</sub> H <sub>37</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	447,29	448
1279		C <sub>28</sub> H <sub>40</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	464,32	465
1280		C <sub>30</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	469,27	470
1281		C <sub>30</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	482,27	483
1282		C <sub>30</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	485,27	486
1283		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S	471,22	472

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1284		C <sub>29</sub> H <sub>39</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	461,30	462
1285		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	435,25	436
1286		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	461,28	462
1287		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	409,27	410
1288		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S	485,23	486
1289		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	450,30	451
1290		C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	449,21	450
1291		C <sub>29</sub> H <sub>41</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	463,32	464
1292		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	436,25	437
1293		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	437,27	438
1294		C <sub>25</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	450,21	451
1295		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	393,24	394

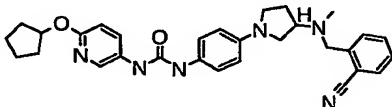
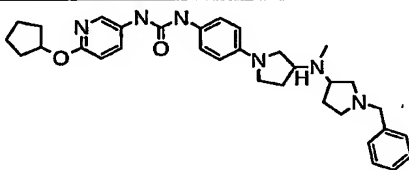
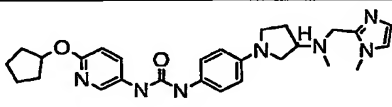
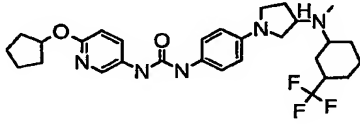
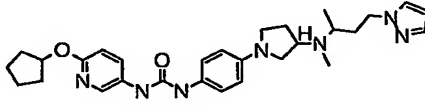
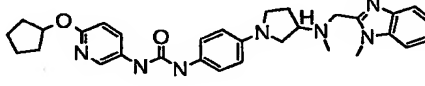
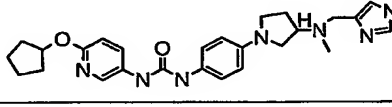
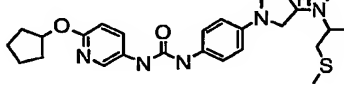
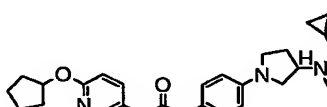
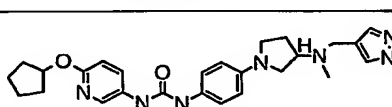
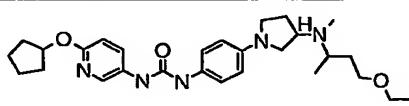
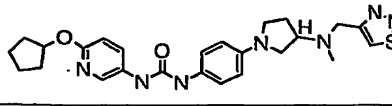
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1296		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	437,28	438
1297		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	463,30	464
1298		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>6</sub> O <sub>2</sub> S	492,23	493
1299		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	439,26	440
1300		C <sub>28</sub> H <sub>40</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	485,30	486
1301		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	453,28	454
1302		C <sub>31</sub> H <sub>37</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	511,30	512
1303		C <sub>28</sub> H <sub>39</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	477,31	478
1304		C <sub>27</sub> H <sub>39</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	465,31	466
1305		C <sub>27</sub> H <sub>39</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	465,31	466
1306		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub> S	481,25	482
1307		C <sub>26</sub> H <sub>33</sub> N <sub>7</sub> O <sub>2</sub>	475,27	476
1308		C <sub>26</sub> H <sub>35</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	449,28	450

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1309		C <sub>26</sub> H <sub>37</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	467,29	468
1310		C <sub>26</sub> H <sub>37</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	467,29	468
1311		C <sub>26</sub> H <sub>37</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	467,29	468
1312		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	479,29	480
1313		C <sub>27</sub> H <sub>39</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	481,30	482
1314		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> N <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	490,31	491
1315		C <sub>28</sub> H <sub>39</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub>	509,30	510
1316		C <sub>28</sub> H <sub>39</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	477,31	478
1317		C <sub>29</sub> H <sub>40</sub> N <sub>6</sub> O <sub>3</sub>	520,32	521
1318		C <sub>30</sub> H <sub>44</sub> N <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	520,35	521
1319		C <sub>30</sub> H <sub>44</sub> N <sub>6</sub> O <sub>3</sub>	536,35	537

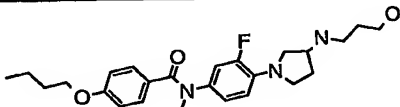
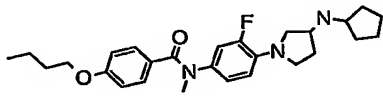
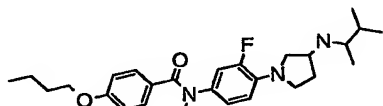
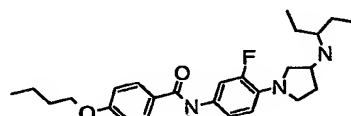
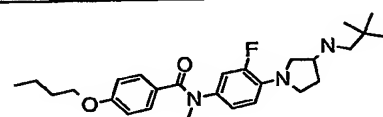
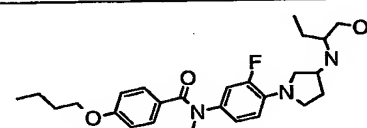
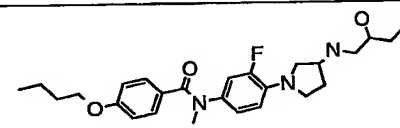
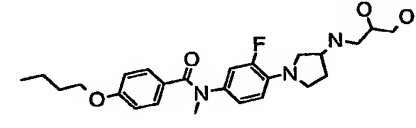
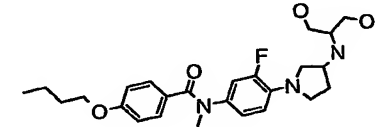
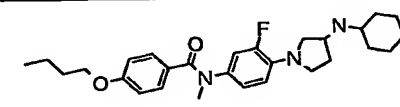
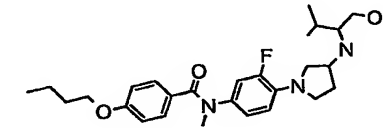


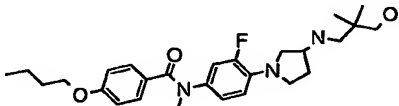
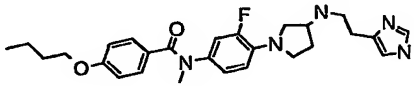
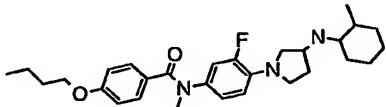
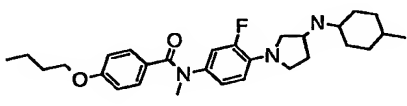
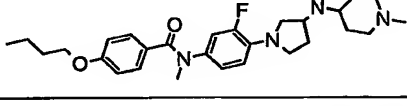
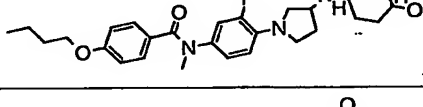
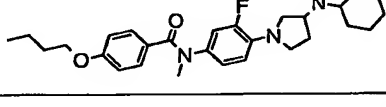
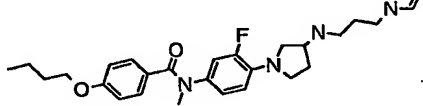
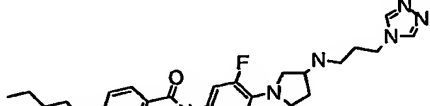
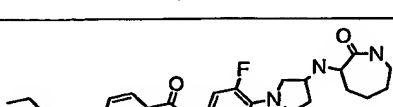
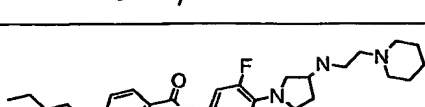
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1320		C30H34N6O2	510,27	511
1321		C33H42N6O2	554,34	555
1322		C27H35N7O2	489,29	490
1323		C29H38F3N5O2	545,30	546
1324		C29H39N7O2	517,32	518
1325		C31H37N7O2	539,30	540
1326		C26H33N7O2	475,27	476
1327		C26H37N5O2S	483,27	484
1328		C26H35N5O2	449,28	450
1329		C27H35N7O2	489,29	490
1330		C28H41N5O3	495,32	496
1331		C25H31N7O2S	493,23	494

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1332		C <sub>31</sub> H <sub>39</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	529,30	530
1333		C <sub>30</sub> H <sub>42</sub> N <sub>6</sub> O <sub>4</sub>	550,33	551
1334		C <sub>28</sub> H <sub>41</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	479,33	480
1335		C <sub>29</sub> H <sub>30</sub> F <sub>2</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	504,58	505
1336		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	425,25	426
1337		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,26	428
1338		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	429,24	430
1339		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	439,26	440
1340		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	439,26	440
1341		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,26	444
1342		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,26	444

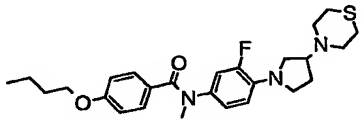
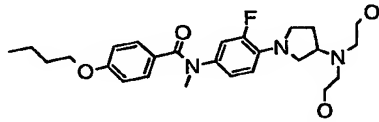
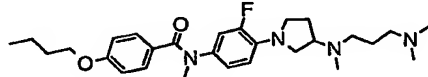
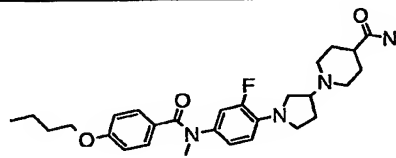
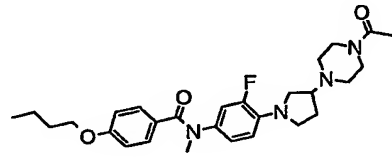
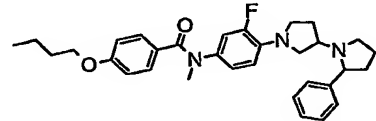
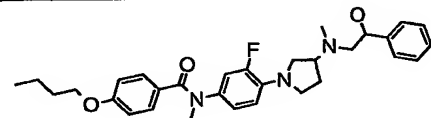
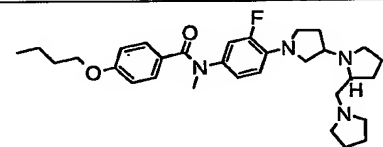
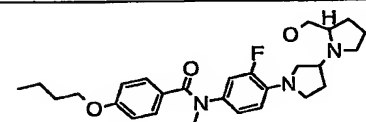
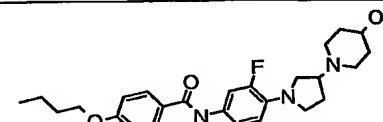
APD62429PC

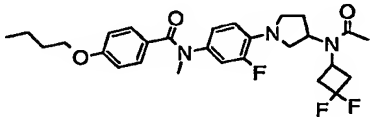
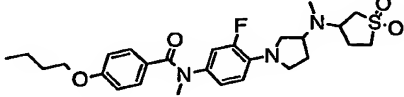
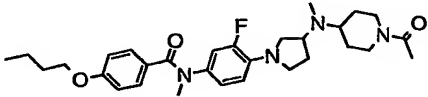
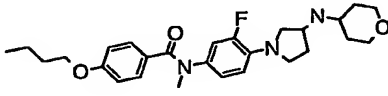
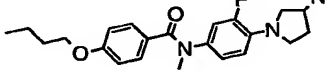
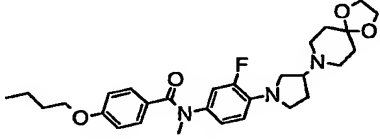
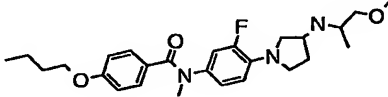
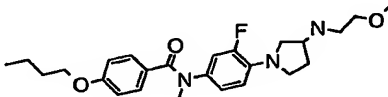
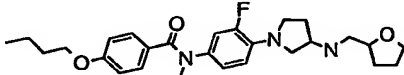
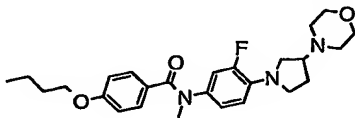
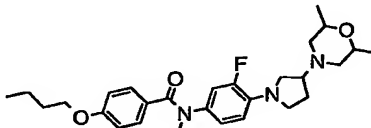
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1343		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,26	444
1344		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	453,28	454
1345		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	455,30	456
1346		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	455,30	456
1347		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	455,30	456
1348		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	457,27	458
1349		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	457,27	458
1350		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	459,25	460
1351		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	459,25	460
1352		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	467,30	468
1353		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	471,29	472

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1354		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	471,29	472
1355		C <sub>27</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	479,27	480
1356		C <sub>29</sub> H <sub>40</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	481,31	482
1357		C <sub>29</sub> H <sub>40</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	481,31	482
1358		C <sub>28</sub> H <sub>39</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	482,31	483
1359		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	483,29	484
1360		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	483,29	484
1361		C <sub>28</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	493,29	494
1362		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	494,28	495
1363		C <sub>28</sub> H <sub>37</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	496,29	497
1364		C <sub>29</sub> H <sub>41</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	496,32	497

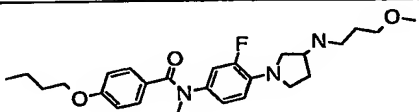
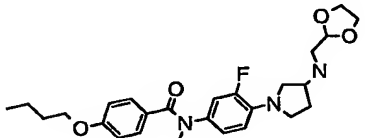
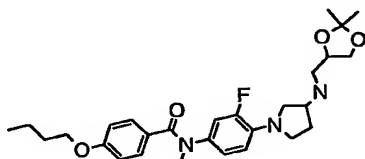
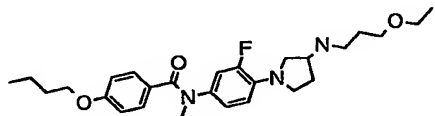
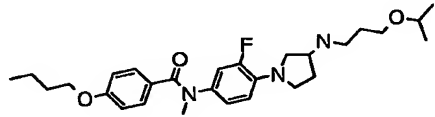
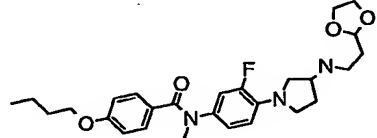
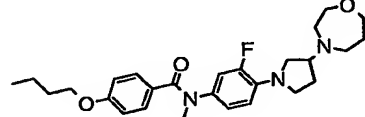
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1365		C <sub>28</sub> H <sub>39</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	498,30	499
1366		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	469,24	470
1367		C <sub>29</sub> H <sub>40</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	497,30	498
1368		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	438,24	439
1369		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	439,26	440
1370		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	441,28	442
1371		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,26	444
1372		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	453,28	454
1373		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	455,26	456
1374		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	467,30	468
1375		C <sub>27</sub> H <sub>37</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	468,29	469

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1376		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	471,24	472
1377		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	473,27	474
1378		C <sub>28</sub> H <sub>41</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	484,32	485
1379		C <sub>28</sub> H <sub>37</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	496,29	497
1380		C <sub>28</sub> H <sub>37</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	496,29	497
1381		C <sub>32</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	515,29	516
1382		C <sub>31</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	519,29	520
1383		C <sub>31</sub> H <sub>43</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	522,34	523
1384		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	469,27	470
1385		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	469,27	470

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1386		C <sub>28</sub> H <sub>34</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	517,26	518
1387		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S	517,24	518
1388		C <sub>30</sub> H <sub>41</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	524,32	525
1389		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	469,27	470
1390		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	385,22	386
1391		C <sub>29</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	511,29	512
1392		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	457,27	458
1393		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	443,26	444
1394		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	469,27	470
1395		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	455,26	456
1396		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	483,29	484

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1397		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	457,27	458
1398		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	471,25	472
1399		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	499,29	500
1400		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	471,29	472
1401		C <sub>28</sub> H <sub>40</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	485,30	486
1402		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	485,27	486
1403		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	469,27	470

## 5 Tabelle 11

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
----------	----------	--------------	---------------------------	------------------



APD62429PC

1404		C22H30N4O2	382,24	383
1405		C24H31ClN4O	426,22	427
1406		C23H32N4O2	396,25	397
1407		C25H27FN4O	418,22	419
1408		C23H32N4O2	396,25	397
1409		C22H30N4O2	382,24	383
1410		C23H25N5O2	403,20	404
1411		C24H33N3O2	395,26	396
1412		C23H31N3O2 (S)- Konfiguration	381,24	382
1413		C23H31N3O2	381,24	382
1414		C23H30FN3O2	399,23	400
1415		C24H32FN3O2	413,25	414

APD62429PC

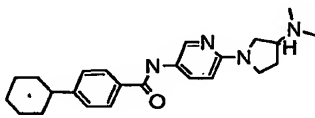
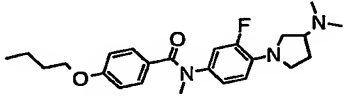
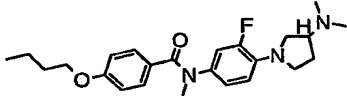
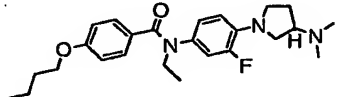
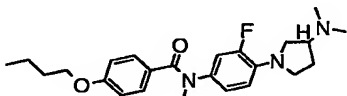
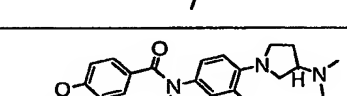
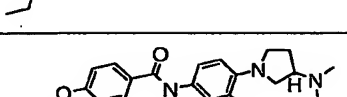
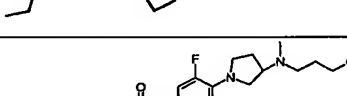
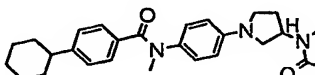
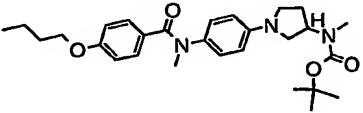
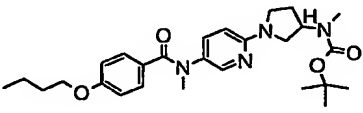
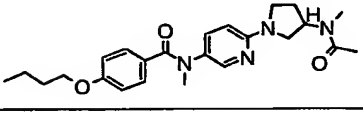
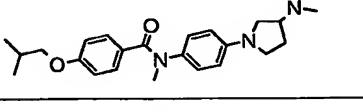
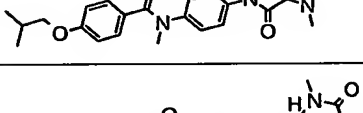
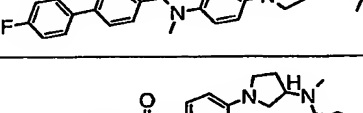
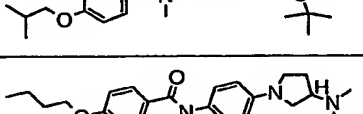
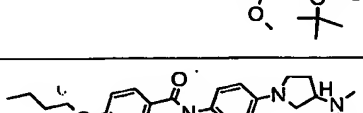
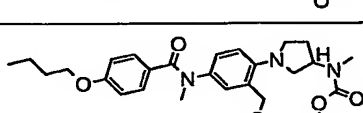
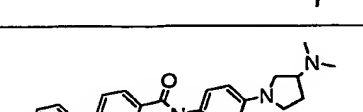
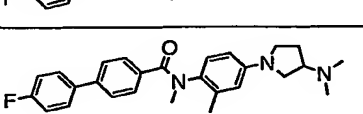

1416		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O	392,26	393
1417		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,25	414
1418		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> (S)- Konfiguration	413,25	414
1419		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,26	428
1420		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	441,28	442
1421		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	441,28	442
1422		C <sub>27</sub> H <sub>36</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	453,28	454
1423		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	471,29	472

Tabelle 12

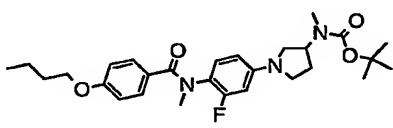
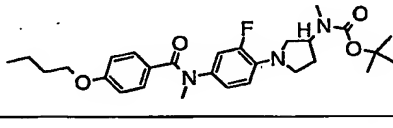
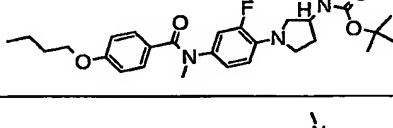
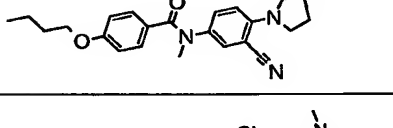
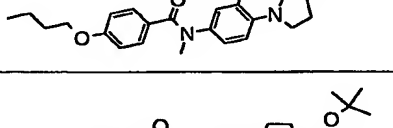
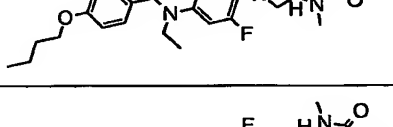
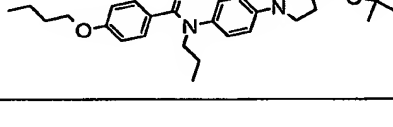
5

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1424		C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	433,27	434

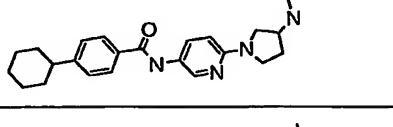
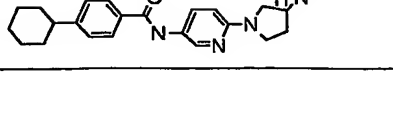
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1425		C <sub>28</sub> H <sub>39</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	481,29	482
1426		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	482,29	483
1427		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	424,25	425
1428		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	395,26	396
1429		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	409,24	410
1430		C <sub>29</sub> H <sub>33</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	504,25	505
1431		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	482,29	483
1432		C <sub>30</sub> H <sub>43</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub>	525,32	526
1433		C <sub>25</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	423,25	424
1434		C <sub>29</sub> H <sub>41</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub>	511,30	512
1435		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O	417,22	418
1436		C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O	431,24	432

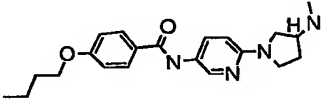
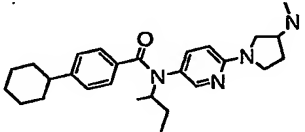
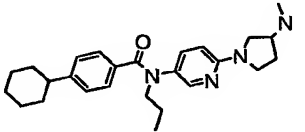
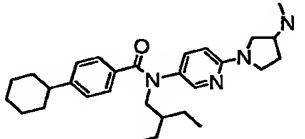
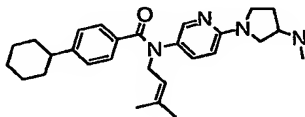
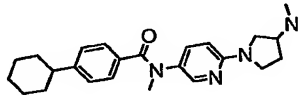
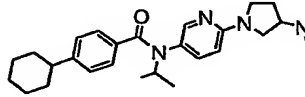
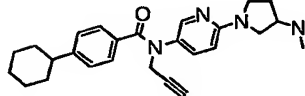
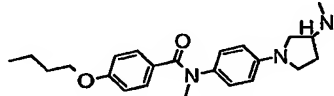
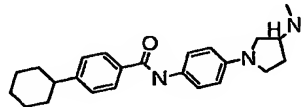
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1437		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	499,29	500
1438		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	499,29	500
1439		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub> (S)-Konfiguration	499,29	500
1440		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	420,25	421
1441		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	429,22	430
1442		C <sub>29</sub> H <sub>40</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	513,30	514
1443		C <sub>30</sub> H <sub>42</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	527,32	528

## 5 Tabelle 13

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1444		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O	378,24	379
1445		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O	378,24	379

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1446		C <sub>21</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	368,22	369
1447		C <sub>27</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O	434,30	435
1448		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O	420,29	421
1449		C <sub>29</sub> H <sub>42</sub> N <sub>4</sub> O	462,34	463
1450		C <sub>28</sub> H <sub>38</sub> N <sub>4</sub> O	446,30	447
1451		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O	392,26	393
1452		C <sub>26</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O	420,29	421
1453		C <sub>26</sub> H <sub>32</sub> N <sub>4</sub> O	416,26	417
1454		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	381,24	382
1455		C <sub>24</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O	377,25	378

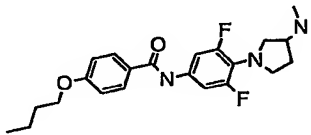
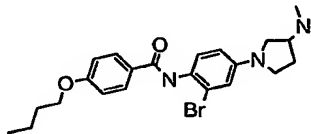
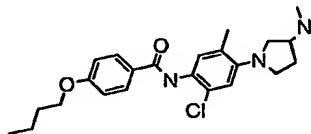
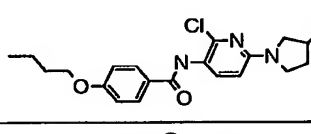
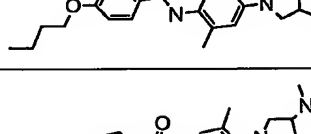
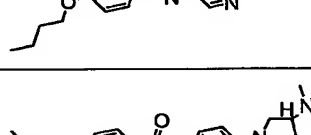
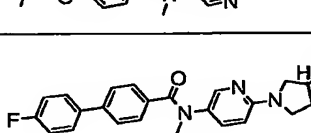
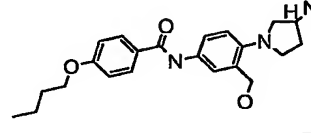
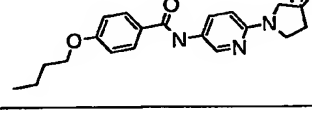

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1456		C <sub>22</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	367,23	368
1457		C <sub>22</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>4</sub> O	376,17	377
1458		C <sub>20</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	354,21	355
1459		C <sub>23</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	388,19	389
1460		C <sub>22</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O	398,19	399
1461		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	382,24	383
1462		C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	375,17	376
1463		C <sub>22</sub> H <sub>27</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	403,21	404
1464		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	385,22	386
1465		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	401,19	402

APD62429PC

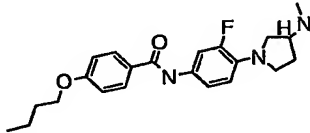
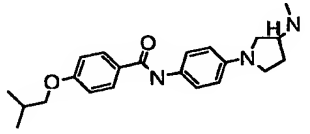
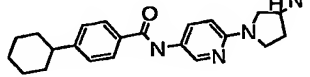
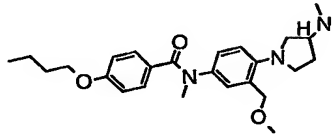
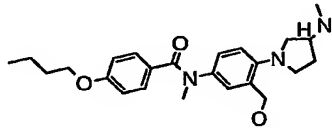
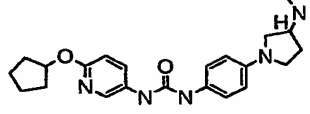
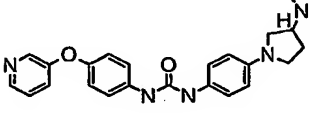
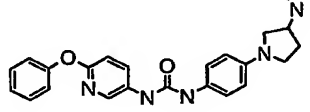
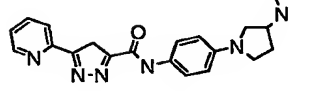
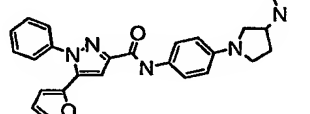
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1466		C <sub>23</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	381,24	382
1467		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	435,21	436
1468		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	435,21	436
1469		C <sub>22</sub> H <sub>27</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	403,21	404
1470		C <sub>22</sub> H <sub>27</sub> ClF <sub>1</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	419,18	420
1471		C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	392,22	393
1472		C <sub>23</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	426,18	427
1473		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> BrN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	445,14	446
1474		C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	417,24	418

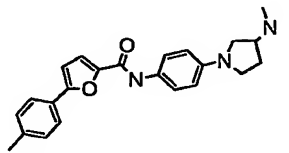
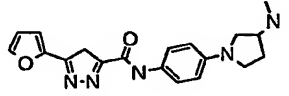
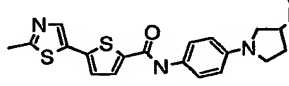
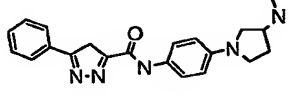
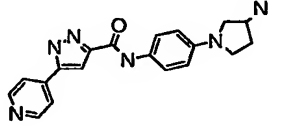
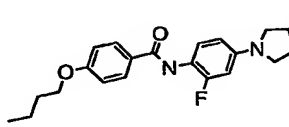
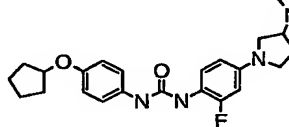
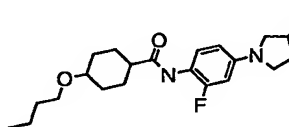
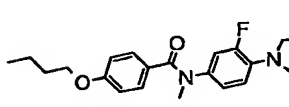
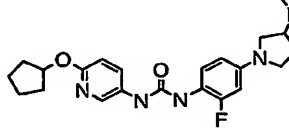
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1475		C <sub>22</sub> H <sub>27</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	403,21	404
1476		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> BrN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	445,14	446
1477		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	415,20	416
1478		C <sub>21</sub> H <sub>27</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	402,18	403
1479		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	382,24	383
1480		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	382,24	383
1481		C <sub>22</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	382,24	383
1482		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O	404,20	405
1483		C <sub>22</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	383,22	384
1484		C <sub>20</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	354,21	355

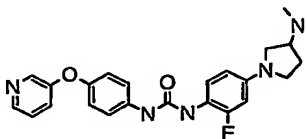
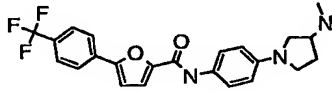
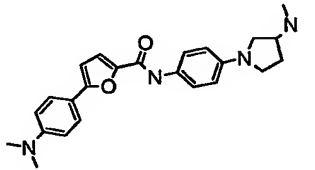
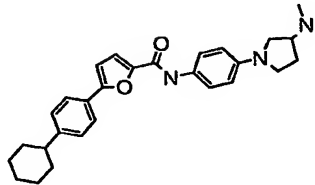
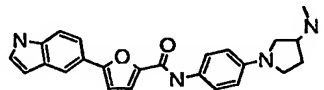
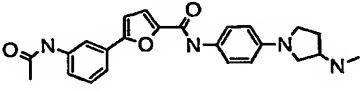
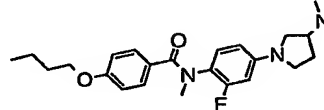
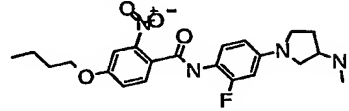
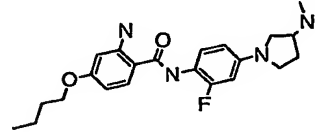
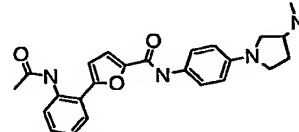


APD62429PC

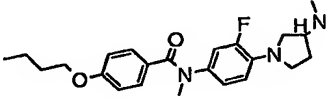
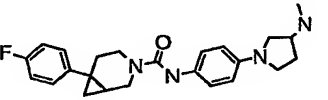
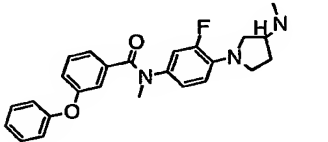
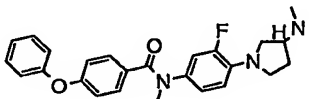
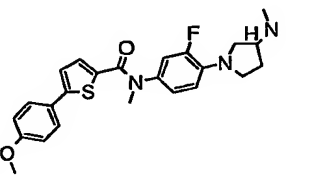
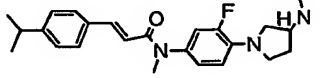
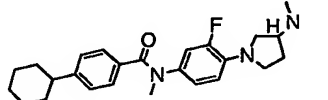
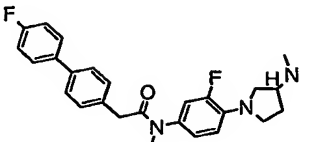
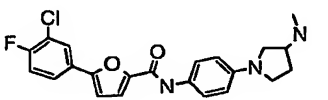
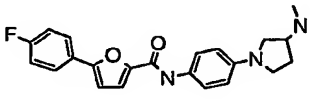
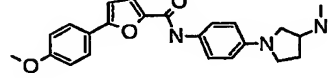
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1485		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	385,22	386
1486		C <sub>22</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	367,23	368
1487		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O	364,23	365
1488		C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	425,27	426
1489		C <sub>24</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	411,25	412
1490		C <sub>22</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	395,23	396
1491		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	403,20	404
1492		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	403,20	404
1493		C <sub>20</sub> H <sub>22</sub> N <sub>6</sub> O	362,19	363
1494		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	427,20	428

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1495		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	375,20	376
1496		C <sub>19</sub> H <sub>21</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	351,17	352
1497		C <sub>20</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> OS <sub>2</sub>	398,12	399
1498		C <sub>21</sub> H <sub>23</sub> N <sub>5</sub> O	361,19	362
1499		C <sub>20</sub> H <sub>22</sub> N <sub>6</sub> O	362,19	363
1500		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	385,22	386
1501		C <sub>23</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	412,23	413
1502		C <sub>22</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	391,26	392
1503		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,23	400
1504		C <sub>22</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	413,22	414

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1505		C <sub>23</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	421,19	422
1506		C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	429,17	430
1507		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	404,22	405
1508		C <sub>28</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	443,26	444
1509		C <sub>24</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	400,19	401
1510		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	418,20	419
1511		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,23	400
1512		C <sub>22</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	430,20	431
1513		C <sub>22</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	400,23	401
1514		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	418,20	419

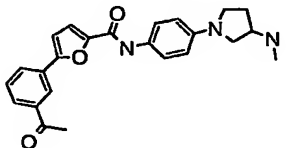
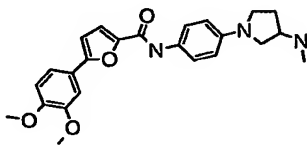
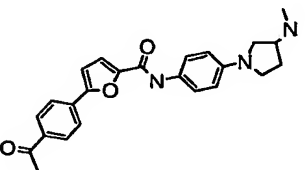
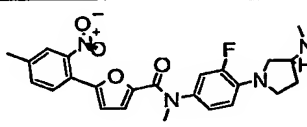
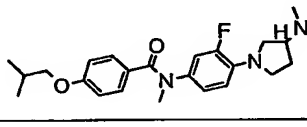
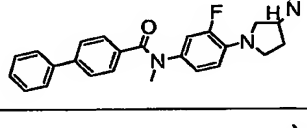
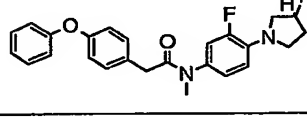
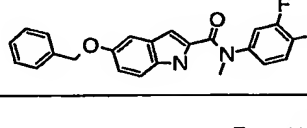
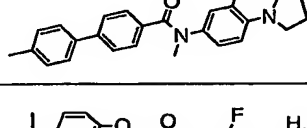
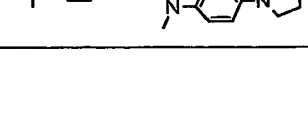
APD62429PC

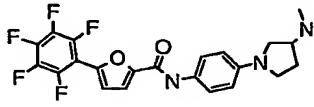
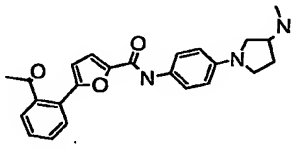
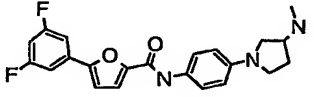
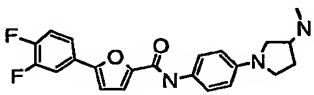
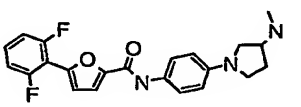
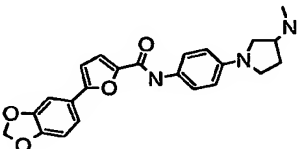
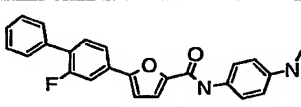
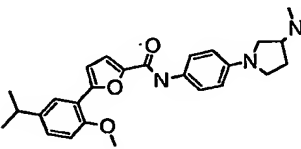
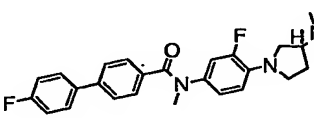
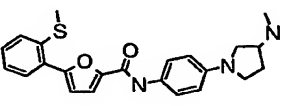
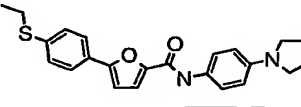
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1515		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,23	400
1516		C <sub>24</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O	408,23	409
1517		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	419,20	420
1518		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	419,20	420
1519		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	439,17	440
1520		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O	395,24	396
1521		C <sub>25</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O	409,25	410
1522		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	435,21	436
1523		C <sub>22</sub> H <sub>21</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,13	414
1524		C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	379,17	380
1525		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	391,19	392

APD62429PC

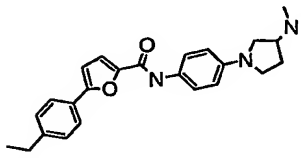
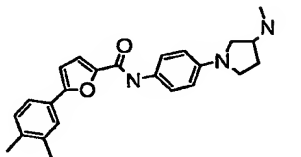
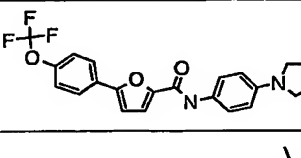
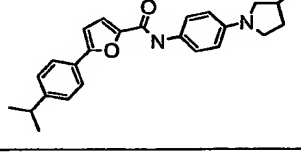
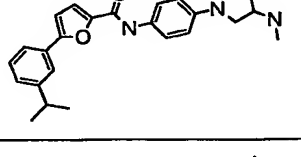
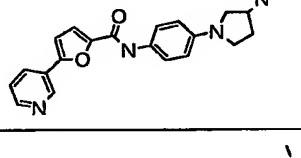
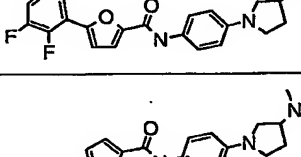
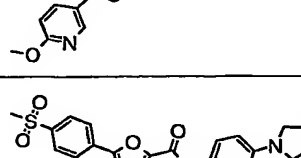

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1526		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	391,19	392
1527		C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	379,17	380
1528		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	407,17	408
1529		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	375,20	376
1530		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	405,20	406
1531		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,23	400
1532		C <sub>25</sub> H <sub>31</sub> ClFN <sub>3</sub> O	443,21	444
1533		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	457,16	458
1534		C <sub>24</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	411,23	412
1535		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	405,20	406
1536		C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	386,17	387

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1537		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	403,19	404
1538		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	421,20	422
1539		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	403,19	404
1540		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	452,19	453
1541		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,23	400
1542		C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O	403,21	404
1543		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	433,22	434
1544		C <sub>28</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	472,23	473
1545		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O	417,22	418
1546		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,25	414

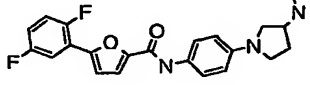
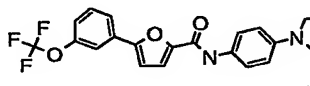
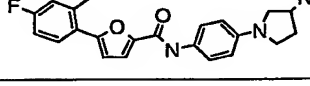
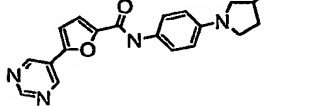
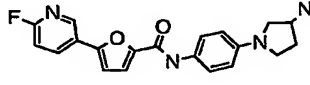
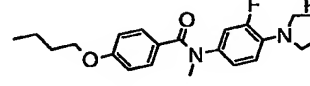
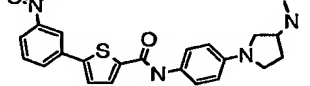
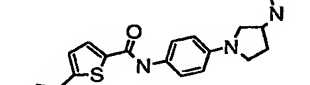
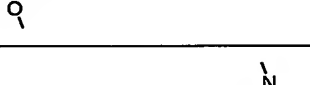
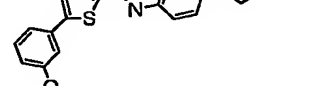
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1547		C <sub>22</sub> H <sub>18</sub> F <sub>5</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	451,13	452
1548		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	403,19	404
1549		C <sub>22</sub> H <sub>21</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	397,16	398
1550		C <sub>22</sub> H <sub>21</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	397,16	398
1551		C <sub>22</sub> H <sub>21</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	397,16	398
1552		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>	405,17	406
1553		C <sub>28</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	455,20	456
1554		C <sub>26</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	433,24	434
1555		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	421,20	422
1556		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	407,17	408
1557		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	421,18	422

APD62429PC

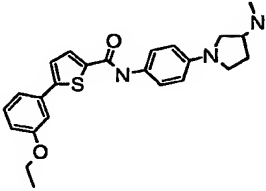
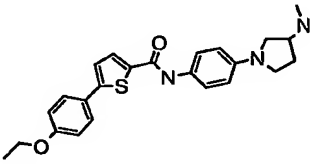
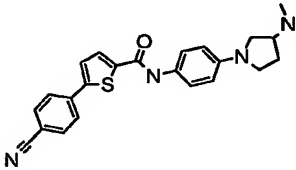
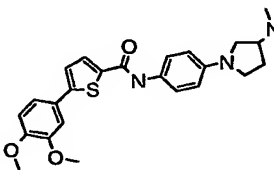
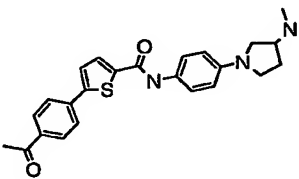
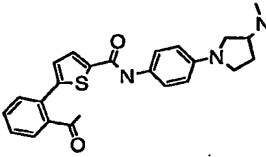
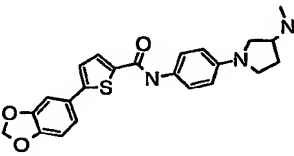
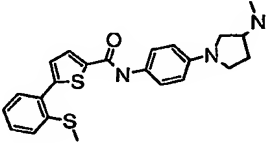
Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1558		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	389,21	390
1559		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	389,21	390
1560		C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	445,16	446
1561		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	403,23	404
1562		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	403,23	404
1563		C <sub>21</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	362,17	363
1564		C <sub>22</sub> H <sub>21</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	397,16	398
1565		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	392,18	393
1566		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S	439,16	440



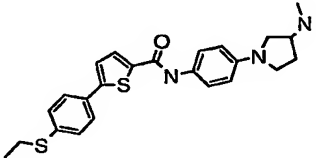
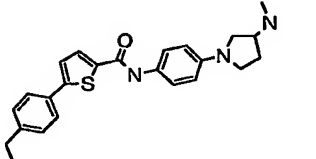
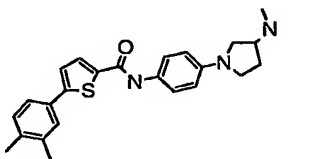
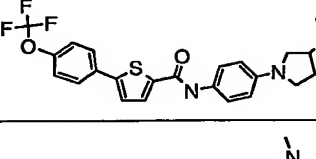
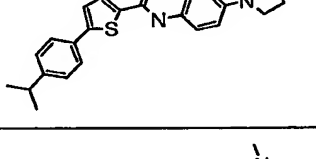
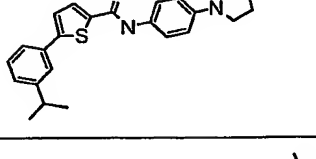
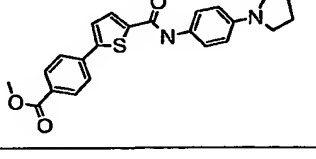
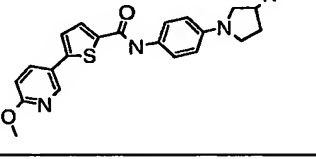
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1567		C <sub>22</sub> H <sub>21</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	397,16	398
1568		C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	445,16	446
1569		C <sub>23</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	393,18	394
1570		C <sub>20</sub> H <sub>21</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	363,17	364
1571		C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	380,17	381
1572		C <sub>23</sub> H <sub>30</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	399,23	400
1573		C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	422,14	423
1574		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	407,17	408
1575		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	407,17	408
1576		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> OS <sub>2</sub>	423,14	424

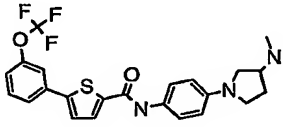
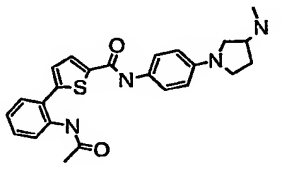
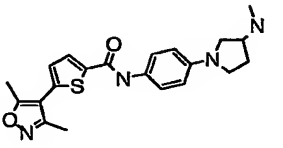
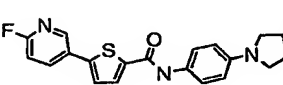
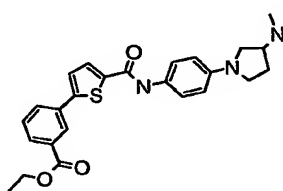
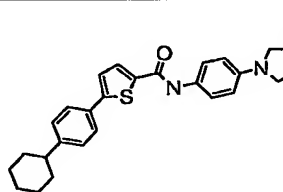
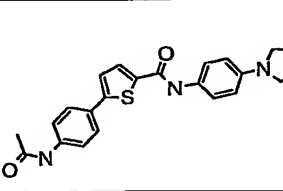
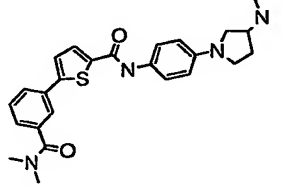
APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1577		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	421,18	422
1578		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	421,18	422
1579		C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	402,15	403
1580		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	437,18	438
1581		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	419,17	420
1582		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	419,17	420
1583		C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	421,15	422
1584		C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>	423,14	424

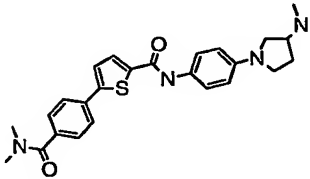
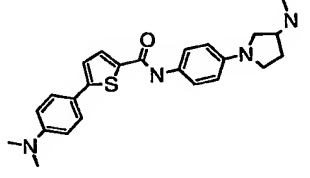
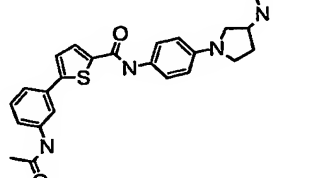
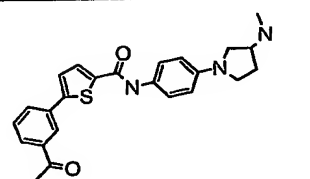
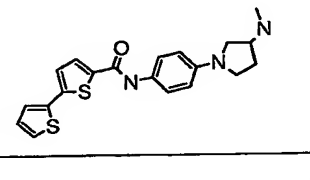
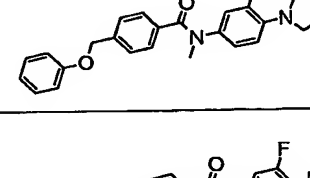
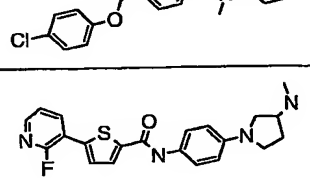

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1585		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> OS <sub>2</sub>	437,16	438
1586		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> OS	405,19	406
1587		C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> OS	405,19	406
1588		C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	461,14	462
1589		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> OS	419,20	420
1590		C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>3</sub> OS	419,20	420
1591		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	435,16	436
1592		C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	408,16	409

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1593		C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	461,14	462
1594		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	434,18	435
1595		C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	396,16	397
1596		C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>4</sub> OS	396,14	397
1597		C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	449,18	450
1598		C <sub>28</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> OS	459,23	460
1599		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	434,18	435
1600		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	448,19	449

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1601		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	448,19	449
1602		C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	420,20	421
1603		C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	434,18	435
1604		C <sub>24</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	419,17	420
1605		C <sub>20</sub> H <sub>21</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	383,11	384
1606		C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	433,22	434
1607		C <sub>26</sub> H <sub>27</sub> ClFN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	467,18	468
1608		C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	396,14	397

APD62429PC

Bsp. No.	Struktur	Summenformel	Monoisotop. Molekulargew.	M+H <sup>+</sup>
1609		C <sub>24</sub> H <sub>32</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	413,25	414
1610		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,26	428
1611		C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	427,26	428
1612		C <sub>26</sub> H <sub>34</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	439,26	440
1613		C <sub>25</sub> H <sub>25</sub> N <sub>3</sub> OS	415,17	416
1614		C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> OS	402,15	403
1615		C <sub>24</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> OS	419,15	420
1616		C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> OS	402,15	403
1617		C <sub>21</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	397,21	398
1618		C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	416,22	417

## 5 Synthesen von als Zwischenstufen benötigten Pyrrolidinylanilinen

APD62429PC

[1-(4-Amino-2-chlor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin

Methode C-a

- Eine Lösung von 2-Chlor-1-fluor-4-nitro-benzol (0,52 g) in DMF (5 mL) wurde  
5 langsam mit 3-Dimethylamino-pyrrolidin (0,34 g) versetzt. Nach 1 Stunde wurde  
die Reaktionsmischung mit Ethylacetat (30 mL) versetzt und mit Salzsäure 10 %  
(2 x 20 mL) extrahiert. Die wässrige Phase wurde mit Ethylacetat (2 x 20 mL)  
gewaschen, mit Ammoniak 10 % auf pH >10 eingestellt und dann mit Ethylacetat  
extrahiert. Die gelbe Lösung wurde mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und am  
10 Rotationsverdampfer konzentriert. Der Rückstand wurde dann in Dichlormethan  
(50 mL) gelöst, Zink (10 g) hinzugegeben und langsam unter Eiskühlung Eisessig  
(5 mL) zuge tropft. Die Suspension wurde 15 Minuten gerührt, filtriert, mit  
Ammoniak 10 % (2 x 20 mL) gewaschen und konzentriert. Man erhielt so das  
Produkt mit dem Molekulargewicht 239,75 (C<sub>12</sub>H<sub>18</sub>ClN<sub>3</sub>); MS (ESI): 239 (M+H<sup>+</sup>),  
15 240 (M+H<sup>+</sup>),

5-Amino-2-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-benzonitril

- Nach Methode C-a wurde Dimethylamino-pyrrolidin mit 2-Fluor-5-nitro-benzonitril  
behandelt und anschließend reduziert. Man erhielt so das Produkt mit dem  
20 Molekulargewicht 230,32 (C<sub>13</sub>H<sub>18</sub>N<sub>4</sub>); MS (ESI): 231 (M+H<sup>+</sup>),

[1-(4-Amino-3-chlor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethylamin

- Nach Methode C-a wurde Dimethylamino-pyrrolidin mit 3-Chlor-1-fluor-4-nitro-  
benzen behandelt und anschließend reduziert. Man erhielt so das Produkt mit dem  
25 Molekulargewicht 239,75 (C<sub>12</sub>H<sub>18</sub>ClN<sub>3</sub>); MS (ESI): 239 (M+H<sup>+</sup>), 240 (M+H<sup>+</sup>),

[1-(4-Amino-3-methyl-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethylamin

- Nach Methode C-a wurde Dimethylamino-pyrrolidin mit 4-Fluor-2-methyl-1-nitro-  
benzen behandelt und anschließend reduziert. Man erhielt so das Produkt mit dem  
30 Molekulargewicht 219,33 (C<sub>13</sub>H<sub>21</sub>N<sub>3</sub>); MS (ESI): 220 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

(R)-[1-(4-Amino-2-fluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Methode C-b

Eine Suspension von 3,4-Difluor-nitrobenzen (1,59 g) und Kaliumcarbonat (2,8 g) in DMF (10 mL) wurde langsam mit (R)-(+)-Pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester (1,86 g) versetzt. Nach 10 Minuten wurde Ethylacetat (50 mL) hinzugefügt, im Scheidetrichter mit Wasser (3 x 50 mL) gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wurde in DMF (10 mL) gelöst und mit Natriumhydrid (0,48 g) versetzt. Nach 15 Minuten wurde dann Methyljodid (1,41 g) unter Eiskühlung zugegeben. Nach 30 Minuten wurde mit Ethylacetat (50 mL) versetzt, im Scheidetrichter mit Wasser (3 x 50 mL) gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeengt. Dann wurde die Substanz wie unter Methode B beschrieben behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 309,39 (C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 310 (M+H<sup>+</sup>).

Analog wurde (S)-[1-(4-Amino-2-fluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester erhalten.

(R)-[1-(2-Fluor-4-isopropylamino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbamic acid tert-butyl ester

(R)-[1-(4-Amino-2-fluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester wurde nach Methode N unter Verwendung von Triacetoxyborhydrid als Reduktionmittel mit Aceton alkyliert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 351,47 (C<sub>19</sub>H<sub>30</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 352 (M+H<sup>+</sup>).

25

(R)-[1-(2-Fluor-4-cyclobutylamino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbamic acid tert-butyl ester

(R)-[1-(4-Amino-2-fluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester wurde nach Methode N unter Verwendung von Triacetoxyborhydrid als Reduktionmittel mit Cyclobutanon alkyliert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 363,48 (C<sub>20</sub>H<sub>30</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 364 (M+H<sup>+</sup>).

30



APD62429PC

(R)-[1-(2-Fluor-4-methylamino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

(R)-{1-[4-(Benzyloxycarbonyl-methyl-amino)-2-fluor-phenyl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-carbamic acid tert-butylester wurde wie unter Methode B beschrieben behandelt.

- 5 Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 323,41 (C<sub>17</sub>H<sub>26</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 324 (M+H<sup>+</sup>).

(R)-{1-[4-(Benzyloxycarbonyl-methyl-amino)-2-fluor-phenyl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-carbamic acid tert-butylester

- 10 Eine Lösung von N-(Benzyloxycarbonyloxy)-succinimid (2,49 g) in Dichlormethan (30 mL) wurde mit (R)-(+)-[1-(4-Amino-2-fluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester (0,93 g) versetzt. Nach 12 Stunden wurde mit Wasser gewaschen (2 x 30 mL), Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Der Rückstand wurde aus Acetonitril umkristallisiert. Das so erhaltene Produkt
- 15 wurde in DMF (10 mL) gelöst und mit Natriumhydrid (0,24 g) versetzt. Nach 15 Minuten wurde unter Eiskühlung mit Methyljodid (0,71 g) versetzt. Es wurde nach 15 Minuten Ethylacetat (50 mL) hinzugegeben, mit Wasser gewaschen (3 x 30 mL), Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 457,55 (C<sub>25</sub>H<sub>32</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 458 (M+H<sup>+</sup>).

20

(R)-[1-(2-Fluor-4-methylamino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin

(R)-{1-[4-(Benzyloxycarbonyl-methyl-amino)-2-fluor-phenyl]-pyrrolidin-3-yl}-methyl-carbamic acid tert-butylester wurde nach Methode G behandelt und das erhaltene Amin nach Methode M methyliert. Abschliessend wurde nach Methode B hydriert.

- 25 Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 237,32 (C<sub>13</sub>H<sub>20</sub>FN<sub>3</sub>); MS (ESI): 238 (M+H<sup>+</sup>).

Analog kann Dimethyl-[1-(4-methylamino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-amin hergestellt werden.

- 30 2-Dimethylamino-N-[1-(2-fluor-4-methylamino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid

APD62429PC

- (R)-[1-[4-(Benzyloxycarbonyl-methyl-amino)-2-fluor-phenyl]-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbamic acid tert-butylester wurde nach Methode G behandelt und das erhaltene Amin nach Methode E mit N,N-Dimethylglycin umgesetzt. Abschliessend wurde nach Methode B hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem
- 5 Molekulargewicht 308,40 (C<sub>16</sub>H<sub>25</sub>FN<sub>4</sub>O); MS (ESI): 309 (M+H<sup>+</sup>).

(R)-[1-(4-Amino-3-fluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

- Nach Methode C-b wurde 2,4-Difluor-nitrobenzen mit (R)-(+)-Pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt, methyliert und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 309,39 (C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 310 (M+H<sup>+</sup>).
- 10

[1-(4-Amino-naphthalen-1-yl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

- 15 Methode C-c
- Eine Suspension von 4-Fluor-1-nitro-naphtalen (1,91 g) und Kaliumcarbonat (2,8 g) in DMF (10 mL) wurde langsam mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester (1,86 g) versetzt. Nach 10 Minuten wurde Ethylacetat (50 mL) hinzugefügt, im Scheidetrichter mit Wasser (3 x 50 mL) gewaschen, mit
- 20 Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Dann wurde die Substanz wie unter Methode B beschrieben behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 341,46 (C<sub>20</sub>H<sub>27</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 342 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(4-Amino-3-brom-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

- 25 Nach Methode C-a wurde 2-Brom-4-fluor-1-nitro-benzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend reduziert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 370,29 (C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>BrN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 370 (M+H<sup>+</sup>), 372 (M+H<sup>+</sup>).

- 30 [1-(4-Amino-3-cyano-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester
- Nach Methode C-a wurde 2-Cyano-4-fluor-1-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend reduziert. Man erhielt

APD62429PC

so das Produkt mit dem Molekulargewicht 316,41 (C<sub>17</sub>H<sub>24</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 317 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(5-Amino-6-chlor-pyridin-2-yl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-

5 butylester

Nach Methode C-c wurde 2-Chlor-6-fluor-3-nitro-pyridin mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 326,83 (C<sub>15</sub>H<sub>23</sub>ClN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 326 (M+H<sup>+</sup>), 327 (M+H<sup>+</sup>).

10

[1-(4-Amino-2,3-difluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-

butylester

Nach Methode C-c wurde 2,3,4-Trifluor-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 327,38 (C<sub>16</sub>H<sub>23</sub>F<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 328 (M+H<sup>+</sup>).

15

[1-(4-Amino-2-brom-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-a wurde 3-Brom-4-fluor-1-nitro-benzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend reduziert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 370,29 (C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>BrN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 370 (M+H<sup>+</sup>), 372 (M+H<sup>+</sup>).

20

[1-(4-Amino-2,6-difluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-

25 butylester

Nach Methode C-c wurde 3,4,5-Trifluor-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 327,38 (C<sub>16</sub>H<sub>23</sub>F<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 328 (M+H<sup>+</sup>).

30

(R)-[1-(4-Amino-2-hydroxymethyl-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester

APD62429PC

Nach Methode C-c wurde (2-Fluor-5-nitro-phenyl)-methanol mit (R)-(+)-Pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 307,40 (C<sub>16</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 308 (M+H<sup>+</sup>).

5

[1-(4-Amino-2-chlor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester  
Nach Methode C-c wurde 2-Chlor-1-fluor-4-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 311,81 (C<sub>15</sub>H<sub>22</sub>ClN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 311 (M+H<sup>+</sup>), 312 (M+H<sup>+</sup>).

10

[1-(4-Amino-2,5-difluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

15

Nach Methode C-c wurde 3,4,6-Trifluor-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 327,38 (C<sub>16</sub>H<sub>23</sub>F<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 328 (M+H<sup>+</sup>).

20

[1-(4-Amino-2-methyl-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester  
Nach Methode C-c wurde 4-Fluor-3-methyl-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 291,40 (C<sub>16</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 292 (M+H<sup>+</sup>).

25

[1-(4-Amino-3-trifluormethyl-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

30

Nach Methode C-c wurde 4-Fluor-2-trifluormethyl-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 345,37 (C<sub>16</sub>H<sub>22</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 346 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

[1-(4-Amino-2-chlor-3-fluor-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-c wurde 2,4-Difluor-3-chlor-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt  
5 so das Produkt mit dem Molekulargewicht 329,80 (C<sub>15</sub>H<sub>21</sub>ClN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 329 (M+H<sup>+</sup>), 330 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(4-Amino-2-cyano-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-c wurde 3-Cyano-4-fluor-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so  
10 das Produkt mit dem Molekulargewicht 302,38 (C<sub>16</sub>H<sub>22</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 303 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(4-Amino-5-chlor-2-methyl-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-c wurde 1-Chlor-5-fluor-4-methyl-2-nitro-benzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 325,84 (C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>ClN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>);  
15 MS (ESI): 325 (M+H<sup>+</sup>), 326 (M+H<sup>+</sup>).

(R)-[1-(5-Amino-pyridin-2-yl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-b wurde 2-Chlor-5-nitro-pyridin mit (R)-(+)-Pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so  
20 das Produkt mit dem Molekulargewicht 322,37 (C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 323 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(5-Amino-pyridin-2-yl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-c wurde 2-Chlor-5-nitro-pyridin mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so  
30 das Produkt mit dem Molekulargewicht 322,37 (C<sub>16</sub>H<sub>24</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 323 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

(R)-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-b wurde 4-Fluor-nitrobenzen mit (R)-(+)-Pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 291,40 (C<sub>16</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 292 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(4-Amino-2-trifluormethyl-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-c wurde 4-Fluor-3-trifluormethyl-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 345,37 (C<sub>16</sub>H<sub>22</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 346 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(5-Amino-4-methyl-pyridin-2-yl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-c wurde 2-Chlor-4-methyl-5-nitro-pyridin mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 306,419 (C<sub>16</sub>H<sub>26</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 306 (M+H<sup>+</sup>), 307 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(5-Amino-3-methyl-pyridin-2-yl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-c wurde 2-Chlor-3-methyl-5-nitro-pyridin mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 306,419 (C<sub>16</sub>H<sub>26</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 306 (M+H<sup>+</sup>), 307 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(4-Amino-2-hydroxymethyl-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-c wurde (2-Fluor-5-nitro-phenyl)-methanol mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man

APD62429PC

erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 321,42 (C<sub>17</sub>H<sub>27</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 322 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(4-Amino-3-chlor-2-cyano-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester

Nach Methode C-c wurde 2-Chlor-6-fluor-3-nitro-benzonitril mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 350,85 (C<sub>17</sub>H<sub>23</sub>ClN<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 350 (M+H<sup>+</sup>), 351 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(4-Amino-3-methyl-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester  
Nach Methode C-c wurde 4-Fluor-2-methyl-nitrobenzen mit Methyl-pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 291,40 (C<sub>16</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 292 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(5-Amino-pyridin-2-yl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester  
Nach Methode C-c wurde 2-Chlor-5-nitro-pyridin mit (R)-(+)-Pyrrolidin-3-yl-carbaminsäure tert-butylester behandelt und anschließend hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 278,36 (C<sub>14</sub>H<sub>22</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 279 (M+H<sup>+</sup>).

5-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-pyridin-2-ylamin

Eine Suspension aus 5-Brom-2-nitropyridin (2 g), 3-(Dimethylamino)-pyrrolidin (1,14 g), (R)-(+)-2,2'-bis(diphenylphosphino)-1,1'-binaphthyl (0,5 g),

Palladium(II)acetat (0,09 g), Cäsiumcarbonat (4,5 g) in Toluol (20 mL) wurden 3 Stunden auf 100 °C erwärmt. Nach dem Abkühlen auf Raumtemperatur wurde mit Salzsäure 1N (2 x 100 mL) extrahiert. Die wässrige Phase wurde mit Ammoniak auf pH > 10 eingestellt, mit Ethylacetat (2 x 100 mL) extrahiert, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingedunstet. Dann wurde die Substanz wie unter Methode B beschrieben behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 206,29 (C<sub>11</sub>H<sub>18</sub>N<sub>4</sub>); MS (ESI): 207 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PG

N-[1-(4-Amino-phenyl)-4-hydroxy-pyrrolidin-3-yl]-N-methyl-acetamid

Trans-N-(4-Hydroxy-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid wurde nach Methode C mit 4-Fluornitrobenzol umgesetzt und das Produkt anschließend nach Methode B  
5 hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 249,32 (C<sub>13</sub>H<sub>19</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 250 (M+H<sup>+</sup>).

Trans-N-(4-Hydroxy-pyrrolidin-3-yl)-N-methyl-acetamid

Trans-3-Hydroxy-4-methylamino-pyrrolidin-1-carbonsäure tert-butylester (1.0 g,  
10 Tetrahedron: Asymmetry 2001, 12, 2989) wurde mit Pyridin (1,5 g) und Acetanhydrid (0.567 g) versetzt. Nach 3 Stunden wurden flüchtige Anteile im Hochvakuum entfernt. Der Rückstand wurde nach Methode G behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 158,20 (C<sub>7</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 159 (M+H<sup>+</sup>).

15

Trans-1-(4-Amino-phenyl)-4-dimethylamino-pyrrolidin-3-ol

6-Oxa-3-aza-bicyclo[3.1.0]hexane-3-carbonsäure tert-butylester (2.0 g, Tetrahedron: Asymmetry 2001, 12, 2989) wurde 12 Stunden mit Dimethylamin (40% aq., 10 mL) gerührt. Die Mischung wurde eingeengt und zwischen Wasser  
20 und Ethylacetat verteilt. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeengt. Das Rohprodukt wurde nach Methode G behandelt. Das erhaltene Amin wurde nach Methode C mit 4-Fluornitrobenzol umgesetzt. Die erhaltene Nitroverbindung wurde nach Methode B hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 221 (C<sub>12</sub>H<sub>19</sub>N<sub>3</sub>O); MS (ESI): 222 (M+H<sup>+</sup>).

25

[1-(4-Amino-phenyl)-4-methoxy-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin

Alternativ kann die in der vorhergehenden Vorschrift hergestellte Nitroverbindung nach Methode F mit Methyljodid alkyliert und dann nach Methode B hydriert werden. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 235 (C<sub>13</sub>H<sub>21</sub>N<sub>3</sub>O);  
30 MS (ESI): 236 (M+H<sup>+</sup>).

[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin



APD62429PC

Dimethyl-pyrrolidin-3-yl-amin wurde nach Methode C mit 4-Fluornitrobenzol umgesetzt und das Produkt anschließend nach Methode B hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 205,31 (C<sub>12</sub>H<sub>19</sub>N<sub>3</sub>); MS (ESI): 206 (M+H<sup>+</sup>).

5

1-(4-Amino-phenyl)-3-dimethylamino-pyrrolidin-2-on

- Eine Lösung von 4-Nitroanilin (5.0 g) in Acetonitril (30 mL) wurde mit Trinatriumphosphat (3.56 g) versetzt und bei 0°C 2-Brom-4-chlorbutyrylbromid (11 g) zugesetzt. Nach einer Stunde wurde eine Lösung von Natriumhydroxid (3.2 g) in Wasser (10 mL) zugesetzt und die Mischung bei Raumtemperatur heftig gerührt. Nach 6 Stunden wurde nochmal die gleiche Menge Natronlauge zugesetzt und über Nacht stehen gelassen. Die Reaktionslösung wurde mit Wasser verdünnt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das Rohprodukt (0.5 g) wurde mit Dimethylamin (160 mg) für 3 Stunden in Toluol (20 mL) auf 80°C erwärmt. Die Reaktionslösung wurde mit Wasser verdünnt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Das Rohprodukt wurde nach Methode B hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 219,29 (C<sub>12</sub>H<sub>17</sub>N<sub>3</sub>O); MS (ESI): 220 (M+H<sup>+</sup>).
- Auf analoge Weise wurde 1-(4-Amino-phenyl)-3-(7-aza-bicyclo[2.2.1]hept-7-yl)-pyrrolidin-2-on erhalten.

- 4-[3-(7-Aza-bicyclo[2.2.1]hept-7-yl)-pyrrolidin-1-yl]-phenylamin
- 1-(4-Nitro-phenyl)-3-(7-aza-bicyclo[2.2.1]hept-7-yl)-pyrrolidin-2-on (0.25 g) in THF (10 mL) wurde mit Boran-THF-Komplex (1 M in THF, 0,83 mL) versetzt und 3 Stunden am Rückfluss gekocht. Nach beendeter Reaktion wurde mit Wasser verdünnt und mit Salzsäure (4 N) auf pH 9-10 gestellt. Extraktion in Ethylacetat, Trocknen und Einengen der organischen Phase ergab ein Rohprodukt, dass nach Methode B hydriert wurde. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 257,38 (C<sub>16</sub>H<sub>23</sub>N<sub>3</sub>); MS (ESI): 258 (M+H<sup>+</sup>).

30

(R)-1'-(4-Amino-phenyl)-[1,3']bipyrrolidinyl-2-on

APD62429PC

[1-(4-Nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure tert-butylester wurde nach Methode G behandelt. Das Rohprodukt (1,4 g) gelöst in Acetonitril (20 mL) wurde mit Trinatriumphosphat (0.67 g) und 4-Chlorbuttersäurechlorid (1.1 g) versetzt. Nach 2 Stunden wurde Natriumhydroxid (0.6 g) in Wasser (10 mL) zugesetzt und die Mischung heftig gerührt. Nach 12 Stunden wurde nochmal die gleiche Menge Natronlauge zugesetzt und weitere 24 Stunden gerührt. Die eingeeengte Reaktionslösung wurde zwischen Wasser und Ethylacetat verteilt und die organische Phase getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde nach Methode B hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 245,33 (C<sub>14</sub>H<sub>19</sub>N<sub>3</sub>O); MS (ESI): 246 (M+H<sup>+</sup>).

1-Methyl-piperidin-3-carbonsäure [(R)-1-(4-amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methylamid  
(R)-[1-(4-Nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-methyl-carbaminsäure tert-butylester wurde nach Methode G behandelt und nach Methode E mit 1-Methyl-piperidin-3-carbonsäure umgesetzt. Abschliessend wurde noch nach Methode B hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 316,45 (C<sub>18</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O); MS (ESI): 317 (M+H<sup>+</sup>).

Auf analoge Weise wurde unter Verwendung von N,N-Diemthylglycin (R)-N-[1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-2-dimethylamino-N-methyl-acetamid erhalten.

N-[(R)-1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-N-(2-diethylamino-ethyl)-acetamid  
Nach Methode B wurde N-(2-Diethylamino-ethyl)-N-[(R)-1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 318,47 (C<sub>18</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O); MS (ESI): 319 (M+H<sup>+</sup>).

N-(2-Diethylamino-ethyl)-N-[(R)-1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-acetamid  
Acetylchlorid ((2,9 g) wurde in 50 mL trockenem Dichlormethan gelöst, mit 5,3 mL Triethylamin versetzt, N,N-Diethyl-N'-[(R)-1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-ethan-1,2-diamin (5,8 g) zugegeben und 30 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend (LCMS - Kontrolle) wurde die Reaktion mit Wasser (10 mL) versetzt und mit Dichlormethan (2 x 10 mL) extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen

APD62429PC

wurden über Magnesiumsulfat getrocknet, das Lösungsmittel entfernt und das Rohprodukt über Kieselgel (Dichlormethan/Methanol 10:1) chromatografisch getrennt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 348,45 (C<sub>18</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 349 (M+H<sup>+</sup>).

5

N,N-Diethyl-N'-[(R)-1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-ethan-1,2-diamin (2-Diethylamino-ethyl)-[(R)-1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure-tert-butylester (7,9 g) wurde nach Methode G mit Trifluoressigsäure umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 306,41 (C<sub>16</sub>H<sub>26</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 307 (M+H<sup>+</sup>).

10

(2-Diethylamino-ethyl)-[(R)-1-(4-nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure-tert-butylester

[(R)-1-(4-Nitro-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-carbaminsäure-tert-butylester (6,0 g)

15

wurde in 50 mL N,N-Dimethylformamid gelöst, mit Natriumhydrid (1,1 g) versetzt, 30 Minuten bei Raumtemperatur gerührt und anschließend mit Chlorethyl-diethylamin-Hydrochlorid (4,1 g) versetzt. Anschließend wurde 4 Stunden bei Raumtemperatur unter Feuchtigkeitsausschluß gerührt. Durch Zugabe von Wasser (50 mL) wurde die Reaktion abgebrochen, anschließend wurde mit Ethylacetat (3x50 mL) extrahiert und die vereinigten organischen Phasen über Magnesiumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel entfernt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 406,53 (C<sub>21</sub>H<sub>34</sub>N<sub>4</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 407 (M+H<sup>+</sup>).

20

Piperidin-4-carbonsäure [4-(3-dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-amid

25

Nach Methode E wurde Piperidin-1,4-dicarbonsäure mono-tert-butylester mit [1-(4-amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin umgesetzt und das Produkt dann nach Methode G behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 316,45 (C<sub>18</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O); MS (ESI): 317 (M+H<sup>+</sup>).

30

Synthese von als Zwischenstufen benötigten Aminen

APD62429PC

**Spiro[1,3-benzodioxol-2,1'-cyclopentan]-5-amin**

Eine Lösung von Spiro[5-nitro-1,3-benzodioxol-2,1'-cyclopentan] (8,8 g) in Methanol (90 mL) wurde in Gegenwart von Palladium auf Kohle (10%ig, 0,1 g) bei 6 bar hydriert. Nach 30 Minuten bei Raumtemperatur wurde der Ansatz filtriert und  
5 eingengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 191,23 ( $C_{11}H_{13}NO_2$ ); MS(ESI): 192 ( $M+H^+$ ).

**Spiro[5-nitro-1,3-benzodioxol-2,1'-cyclopentan]**

Eine Lösung von Spiro[1,3-benzodioxol-2,1'-cyclopentan] (8,5 g) in 20 mL  
10 Dichlormethan wurde bei 10°C zu 65 %iger Salpetersäure (65 mL) getropft. Nach 2 Stunden bei 5-10 °C wurde der Ansatz mit Wasser verdünnt, die organische Phase abgetrennt und die wäßrige Phase zweimal mit Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Wasser neutral gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, eingengt und aus Heptan kristallisiert. Man erhielt so  
15 das Produkt mit dem Molekulargewicht 221,21 ( $C_{11}H_{11}NO_4$ ); MS(ESI): 222 ( $M+H^+$ ).

**Spiro[1,3-benzodioxol-2,1'-cyclopentan]**

Brenzcatechin (11g) und Cyclopentanon (9 mL) wurden in Toluol (150 mL) mit p-  
20 Toluolsulfonsäure (0,18 g) am Wasserabscheider zum Rückfluß erhitzt. Nach 18 Stunden wurde der Ansatz eingengt und durch Chromatographie (Kieselgel, Heptan/Ethylacetat 4:1) gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 176,22 ( $C_{11}H_{12}O_2$ ); MS(ESI): 177 ( $M+H^+$ ).

**5-Chlor-2',3',5',6'-tetrahydro-1'H-[2,4']bipyridinyl-4'-ol**

Eine Lösung von 2-Brom-5-chlorpyridin (2,0 g) in Diethylether (50 mL) wurde bei –  
78°C tropfenweise mit Butyllithium (15% in Hexan; 7,6 mL) versetzt und nach einer Stunde eine Lösung von N-tert.-Butoxycarbonyl-4-piperidinon (2,1 g) in Diethylether (10 mL) zugetropft. Nach 30 Minuten wurde vorsichtig Wasser  
30 zugesetzt und die Mischung mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingengt. Der Rückstand wurde

APD62429PC

nach Methode G behandelt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 212,68 (C<sub>10</sub>H<sub>13</sub>ClN<sub>2</sub>O); MS(ESI): 213 (M+H<sup>+</sup>).

Analog wurden erhalten:

5-Fluor-2',3',5',6'-tetrahydro-1'H-[2,4']bipyridinyl-4'-ol

5 6-Chlor-2',3',5',6'-tetrahydro-1'H-[3,4']bipyridinyl-4'-ol.

6-Cyclopentyloxy-pyridin-3-ylamin

Eine Mischung von 2-Hydroxy-5-nitropyridin (1,4 g), Cyclopentylbromid (1,5 g) und Kaliumcarbonat (3 g) wurde in DMF (20 mL) für 6 Stunden auf 80°C erhitzt. Die

10 Mischung wurde mit Wasser verdünnt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch Chromatographie an Kieselgel (Laufmittel Ethylacetat / Heptan 1:2) gereinigt. Die so erhaltene Nitroverbindung wurde nach Methode B

15 hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 178,24 (C<sub>10</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>); MS(ESI): 179 (M+H<sup>+</sup>).

6-(4-Fluor-phenyl)-3-aza-bicyclo[4.1.0]heptan

Diethylzink (1M in Hexan, 19 mL) in Dichlormethan (100 mL) wurde mit Trifluoressigsäure (3 mL) bei 0°C versetzt. Nach 20 Minuten wurde Diiodmethan (3

20 mL) in Dichlormethan (10 mL) zugesetzt. Dann wurde 4-(4-Fluor-phenyl)-1,2,3,6-tetrahydro-pyridin (3.0 g) in Dichlormethan (10 mL) zugesetzt und die Mischung über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Nach Zusatz von Salzsäure (1N) wurden die Phasen getrennt und die organische Phase mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem

25 Molekulargewicht 191,25 (C<sub>12</sub>H<sub>14</sub>FN); MS(ESI): 192 (M+H<sup>+</sup>).

### Synthese von als Zwischenstufen benötigten Carbonsäuren

30 4-(4-Methylpiperidin-1-yl)-benzoesäure

4-(4-Methylpiperidin-1-yl)-benzonitril (1,2 g) wurde mit Kaliumhydroxid (0,7 g) in Wasser (2 mL) und Ethylenglykol (8 mL) für 3 Stunden zum Rückfluß erhitzt. Der

APD62429PC

Ansatz wurde mit Wasser verdünnt, mit Ethylacetat gewaschen und mit 2 N Salzsäure angesäuert. Das ausgefallene Produkt wurde abgesaugt, in Dichlormethan gelöst, über Natriumsulfat getrocknet, eingeeengt und aus Diethylether kristallisiert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht  
5 219,29 (C<sub>13</sub>H<sub>17</sub>NO<sub>2</sub>); MS(ESI): 220 (M+H<sup>+</sup>).

#### 4-(4-Methylpiperidin-1-yl)-benzonitril

4-Fluorbenzonitril (1,21 g) wurde mit 4-Methylpiperidin (1,00 g) für 1 Stunde auf 180°C erhitzt. Anschließend wurde der Ansatz in Ethylacetat aufgenommen, mit  
10 Wasser, 2N Natronlauge und ges. Natriumhydrogencarbonatlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, eingeeengt und aus n-Pentan kristallisiert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 200,29 (C<sub>13</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>); MS(ESI): 201 (M+H<sup>+</sup>).

#### 15 4-Butoxy-cyclohexancarbonsäure

Eine Lösung von 4-Hydroxy-cyclohexancarbonsäure-ethylester (10 g) und Butyljodid (10,6 g) in DMF wurde unter Eiskühlung und Argon mit Natriumhydrid (2,78 g) versetzt. Nach 12 Stunden wurde die Mischung auf Eis (200 g) gegossen, mit Ethylacetat (100 mL) extrahiert und anschließend mit Wasser (3 x 50 mL)  
20 gewaschen. Die organische Phase wurde konzentriert und mit Ethanol (50 mL) und Natriumhydroxid 5N (30 mL) versetzt. Die Lösung wurde 4 Stunden auf 60 °C erwärmt. Nach dem Abkühlen auf Raumtemperatur wurde mit Salzsäure 2N auf pH < 2 eingestellt, mit Ethylacetat extrahiert (3 x 50 mL), Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und konzentriert. Man erhielt so das Produkt mit dem  
25 Molekulargewicht 200,28 (C<sub>11</sub>H<sub>20</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 201 (M+H<sup>+</sup>).

#### 1-Benzyl-1H-[1,2,3]triazol-4-carbonsäure

1-Benzyl-1H-[1,2,3]triazol-4-carbonsäure-methylester (217 mg) wurde in 4 mL Methanol gelöst und mit 2 mL 2N Natronlauge verseift. Nach Ansäuern mit 4 mL  
30 2N Salzsäure wurde der entstehende Niederschlag abfiltriert, in 5 mL Ethylacetat aufgenommen und durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 203,2 (C<sub>10</sub>H<sub>9</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 204 (M+H<sup>+</sup>).

#### 1-Benzyl-1H-[1,2,3]triazol-4-carbonsäure-methylester

Benzylazid (266 mg) wurde zusammen mit Natriumascorbat (20 mg) und Kupfersulfat (5 mg) in 8 mL des Lösungsmittelgemisches (*tert.*Butanol/Wasser 3:1) gelöst und Propionsäuremethylester (336 mg) zugegeben. Die Lösung wurde bei 2 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Es fiel ein weißer Niederschlag aus, der über eine Fritte abgesaugt und anschließend getrocknet wurde. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 217,23 (C<sub>11</sub>H<sub>11</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 218 (M+H<sup>+</sup>).

- 10 Analog wurde 1-Biphenyl-4-yl-1H-[1,2,3]triazol-4-carbonsäure aus 4-Ethynylbiphenyl und Azidoessigsäureethylester hergestellt.

#### 1-Butyl-1H-indole-5-carbonsäure

- 1H-Indole-5-carbonsäure methyl ester (5.0 g) in DMF (100 mL) wurde mit Natriumhydrid (50% in Öl, 1,4 g) versetzt und nach beendeter Gasentwicklung Brombutan (3,9 g) zugesetzt. Nach 12 Stunden wurde die Reaktionslösung mit Ethylacetat verdünnt und dreimal mit Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch Chromatographie an Kieselgel (Laufmittel Ethylacetat / Heptan 1:6) gereinigt. Der erhaltene Ester wurde in Methanol (10 mL) gelöst und mit Natriumhydroxid (0,6 g) in Wasser (10 mL) für 12 Stunden am Rückfluss gekocht. Die Mischung wurde mit Wasser verdünnt und mit Salzsäure sauer gestellt, gefolgt von einer Extraktion mit Ethylacetat. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 217,27 (C<sub>13</sub>H<sub>15</sub>NO<sub>2</sub>); MS (ESI): 218 (M+H<sup>+</sup>).

#### 3'-Acetylamino-biphenyl-4-carbonsäure

- 3'-Amino-biphenyl-4-carbonsäure (0,2 g) wurde mit Pyridin (0,7 g) und Acetanhydrid (180 mg) versetzt und nach 14 Stunden flüchtige Anteile entfernt. Der Rückstand wurde in Natronlauge (2N) aufgenommen und mit Diethylether gewaschen. Die wässrige Phase wurde mit Salzsäure sauer gestellt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat

APD62429PC

getrocknet und eingeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 255,28 (C<sub>15</sub>H<sub>13</sub>NO<sub>3</sub>); MS (ESI): 256 (M+H<sup>+</sup>).

#### 3'-Isobutyrylamino-biphenyl-4-carbonsäure

- 5 3'-Amino-biphenyl-4-carbonsäure (0,2 g) in Dichlormethan wurde mit Kaliumcarbonat (121 mg) und Isobutyrylchlorid (94 mg) versetzt. Nach 12 Stunden wurde die Mischung mit Natronlauge verdünnt und mit Diethylether gewaschen. Die wässrige Phase wurde mit Salzsäure sauer gestellt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und
- 10 eingeengt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 283,33 (C<sub>17</sub>H<sub>17</sub>NO<sub>3</sub>); MS (ESI): 284 (M+H<sup>+</sup>).

#### 5-Butoxy-pyridin-2-carbonsäure

- 15 5-Hydroxy-pyridin-2-carbonsäure benzhydryl ester (2,0 g) gelöst in DMF (20 mL) wurde mit Natriumhydrid (50% in Öl, 250 mg) versetzt und nach beendeter Gasentwicklung 1-Brombutan (0,72 g) zugesetzt. Die Mischung wurde für 6 Stunden auf 90 °C erwärmt. Es wurde mit Wasser verdünnt und mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeengt. Der Rückstand wurde analog der Methode B hydriert. Man erhielt so
- 20 das Produkt mit dem Molekulargewicht 195,22 (C<sub>10</sub>H<sub>13</sub>NO<sub>3</sub>); MS (ESI): 196 (M+H<sup>+</sup>).

#### 4-Methyl-3,4,5,6-tetrahydro-2H-[1,3']bipyridinyl-6'-carbonsäure

- 25 5-Trifluormethanesulfonyloxy-pyridin-2-carbonsäure benzhydryl ester (3,0 g) wurde mit 4-Methylpiperidin (1,4 g) für eine Stunde auf 80 °C erwärmt. Das Reaktionsgemisch wurde direkt durch präparative HPLC gereinigt und anschließend analog der Methode hydriert. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 220,27 (C<sub>12</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 221 (M+H<sup>+</sup>).

- 30 N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-terephthalamid  
Methode P-a



APD62429PC

N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-terephthalamic acid methyl ester (1,7 g) gelöst in Methanol (20 mL) wurde mit Natronlauge (2N, 15 mL) für 24 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Bei unvollständigem Umsatz kann auch zum Rückfluss erwärmt werden. Das organische Lösungsmittel wurde abdestilliert und die Mischung mit Salzsäure sauer gestellt. Der ausgefallene Niederschlag wurde abgesaugt und getrocknet. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 353,42 (C<sub>20</sub>H<sub>23</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 354 (M+H<sup>+</sup>).

N-[4-(3-Dimethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-terephthalamic acid methyl ester [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin wurde nach Methode E mit Terephthalsäuremonomethylester umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 367,45 (C<sub>21</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 368 (M+H<sup>+</sup>).

4-(Cyclopentanecarbonyl-methyl-amino)-benzoesäure  
4-Methylamino-benzoesäuremethylester wurde nach Methode E mit Cyclopentanecarbonsäure umgesetzt und dann nach Methode P-a verseift. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 247,30 (C<sub>14</sub>H<sub>17</sub>NO<sub>3</sub>); MS (ESI): 248 (M+H<sup>+</sup>).

Analog wurden folgende Verbindungen erhalten:

4-(Cyclopentanecarbonyl-amino)-3-methoxy-benzoesäure  
2-Chlor-4-(cyclopentanecarbonyl-amino)-benzoesäure  
2-Fluor-4-(cyclopentanecarbonyl-amino)-benzoesäure  
4-(Cyclopentanecarbonyl-amino)-3-methyl-benzoesäure  
4-(Cyclopentanecarbonyl-amino)-benzoesäure  
4-(Cyclopentanecarbonyl-amino)-3-trifluormethoxy-benzoesäure  
3-Chlor-4-(cyclopentanecarbonyl-amino)-benzoesäure  
5-Chlor-4-(cyclopentanecarbonyl-amino)-2-methoxy-benzoesäure  
4-[(Cyclohex-1-enecarbonyl)-amino]-benzoesäure  
4-[(Cyclopent-1-enecarbonyl)-amino]-benzoesäure

30

3-Fluor-4-(1-methyl-butoxy)-benzoesäure

APD62429PC

- Zu einer Lösung aus 1,36 g NaOH, 1,6 g Brom in 6,8 mL Wasser wurde tropfenweise eine Lösung aus 0,449 g 1-[3-Fluor-4-(1-methyl-butoxy)-phenyl]-ethanon in 6,8 mL Dioxan getropft. Die Mischung wurde 30 Minuten bei Raumtemperatur gerührt und anschließend 1h auf 50 °C erhitzt. Der
- 5 Bromüberschuß wurde durch Zugabe eine Natriumdisulfitlösung zerstört und anschließend die Lösung in 25%ige Salzsäure gegossen und 20 Minuten gerührt. Die Lösung wurde mit Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat getrocknet, im Vakuum eingeeengt und durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 226,1
- 10 (C<sub>12</sub>H<sub>15</sub>FO<sub>3</sub>); MS (ESI): 227 (M+H<sup>+</sup>).

#### 1-[3-Fluor-4-(1-methyl-butoxy)-phenyl]-ethanon

- Zu einer Lösung aus 0,176 g 2-Pentanol in 2 mL DMF wurden 0,058 g NaH gegeben und die Lösung 1 Stunde bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend
- 15 wurden 0,312 g 3,4-Difluoracetophenon zugegen und über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Die Reaktionslösung wurde in Ethylacetat aufgenommen und zweimal mit Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum eingeeengt. Die erhaltene Verbindung wurde ohne weitere Aufreinigung weiter umgesetzt.
- 20 Analog wurden folgende Verbindungen erhalten:
- 4-Cyclobutoxy-3-fluor-benzoesäure
  - 3-Fluor-4-(2-methyl-cyclopropylmethoxy)-benzoesäure
  - 4-(2-Cyclopropyl-ethoxy)-3-fluor-benzoesäure
  - 3-Fluor-4-(1-methyl-piperidin-3-yloxy)-benzoesäure
  - 25 4-(1-Acetyl-piperidin-3-yloxy)-3-fluor-benzoesäure
  - 3-Fluor-4-(1-methyl-pyrrolidin-3-yloxy)-benzoesäure
  - 4-(1-Acetyl-pyrrolidin-3-yloxy)-3-fluor-benzoesäure
  - 3-Fluor-4-(1-methyl-piperidin-3-ylmethoxy)-benzoesäure

30

#### 4-(2,4-Difluorphenoxy)-benzoesäure

APD62429PC

Zu einer Lösung aus 0,428 g 4-(2,4-Difluorphenoxy)-benzoesäureethylester in 2 mL THF / Wasser (1:1) wurden 0,518 g Kaliumhydroxid gegeben. Die Lösung wurde 6 Stunden auf 110 °C erwärmt. Anschließend wurde das THF im Vakuum entfernt, die Wasserphase gefriergetrocknet und durch präparative HPLC gereinigt.

- 5 Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 250,04 (C<sub>13</sub>H<sub>8</sub>F<sub>2</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 251 (M+H<sup>+</sup>).

#### 4-(2,4-Difluorphenoxy)-benzoesäureethylester

Zu einer Lösung aus 0,1 g 2,4-Difluorphenol in 0,5 mL DMF wurden mit 0,018 g

- 10 NaH versetzt. Die Reaktion wurde 45 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurden 0,129 g 4-Fluorbenzoesäureethylester in 0,5 mL DMF zutropft. Die Reaktion wurde über Nacht auf 110 °C erhitzt. Nach dem Abkühlen im Vakuum eingengt und der Rückstand in Ethylacetat /Wasser aufgenommen. Die Ethylacetatphase wurde dreimal mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat  
15 getrocknet, im Vakuum eingengt und durch präparative HPLC gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 278,08 (C<sub>15</sub>H<sub>12</sub>F<sub>2</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 279 (M+H<sup>+</sup>)

Nach Methode E-b wurde 4-(2,4-Difluorphenoxy)-benzoesäure mit [1-(4-Amino-phenyl)-pyrrolidin-3-yl]-dimethyl-amin umgesetzt. Man erhielt so das Produkt mit  
20 dem Molekulargewicht 437,19 (C<sub>25</sub>H<sub>25</sub>F<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>); MS (ESI): 438 (M+H<sup>+</sup>) als Hydrotrifluoracetat.

#### 4-Butoxy-3-methoxy-benzoesäure

4-Hydroxy-3-methoxy-benzoesäure methyl ester wurde nach Methode H mit

- 25 Brombutan alkyliert und nach Methode P-a verseift. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 224,26 (C<sub>12</sub>H<sub>16</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 225 (M+H<sup>+</sup>).

Analog wurden folgende Verbindungen hergestellt:

4-Butoxy-3,5-dichlor-benzoesäure

4-Butoxy-3-nitro-benzoesäure

- 30 4-Butoxy-3-chlor-benzoesäure

4-Butoxy-3,5-dimethyl-benzoesäure

4-Butoxy-2,3-dichlor-5-methoxy-benzoesäure

4-Butoxy-2,3,5,6-tetrafluor-benzoesäure

4-Butoxy-3-fluor-benzoesäure

3-Acetyl-4-butoxy-benzoesäure

2,4-Dibutoxy-benzoesäure

5 4-Butoxy-2-chlor-benzoesäure

4-Propoxymethyl-benzoesäure

Eine Lösung von Propanol (0,6 g) in DMF (8 mL) wurde vorsichtig mit Natriumhydrid (50% in Öl; 0,42g) versetzt. Nach beendeter Gasentwicklung wurde 4-Brommethyl-benzoesäure methyl ester (1,0 g) zugesetzt. Nach 4 Stunden wurde die Mischung zwischen Wasser und Ethylacetat verteilt. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde nach Methode P-a verseift. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 194,23 (C<sub>11</sub>H<sub>14</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 195 (M+H<sup>+</sup>).

15 Analog wurden folgende Verbindungen hergestellt:

4-Ethoxymethyl-benzoesäure

4-Butoxymethyl-benzoesäure

4-Isobutoxymethyl-benzoesäure

4-Phenoxymethyl-benzoesäure

20 4-(Pyridin-3-yloxymethyl)-benzoesäure

4-(Pyridin-2-yloxymethyl)-benzoesäure

4-Benzoimidazol-1-ylmethyl-benzoesäure

4-Indol-1-ylmethyl-benzoesäure

4-Phenylsulfanylmethyl-benzoesäure

25 4-(Pyrimidin-2-ylsulfanylmethyl)-benzoesäure

4-(Pyridin-2-ylsulfanylmethyl)-benzoesäure

4-(2-Cyano-phenoxy-methyl)-benzoesäure

4-(2-Chlor-phenoxy-methyl)-benzoesäure

4-Cyclobutoxymethyl-benzoesäure

30 4-Cyclopentyloxymethyl-benzoesäure

4-Cyclohexyloxymethyl-benzoesäure

4-sec-Butoxymethyl-benzoesäure

APD62429PC

#### 4-Pentoxymethyl-benzoesäure

##### 4-(3-Oxo-3a,4,5,6-tetrahydro-3H-cyclopentapyrazol-2-yl)-benzoesäure

- 5 Eine Lösung von 4-Hydrazinbenzoesäure (0,3 g), Ethyl-2-oxocyclopentancarboxylat (0,31 g) und p-Toluolsulfonsäure (340 mg) in Ethanol (12 mL) wurde für 12 Stunden am Rückfluss gekocht. Die eingeeengte Reaktionslösung wurde durch präparative HPLC gereinigt. Das isolierte Reaktionsprodukt (als Ethylester) wurde nach Methode P-a verseift. Man erhielt so
- 10 das Produkt mit dem Molekulargewicht 244,25 (C<sub>13</sub>H<sub>12</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>); MS (ESI): 245 (M+H<sup>+</sup>).

##### 4-Butoxy-2-methoxy-benzoesäure

- 15 4-Hydroxy-2-methoxy-benzaldehyd wurde nach Methode H mit 1-Brombutan alkyliert. Der erhaltene Aldehyd (6,4 g) in Dioxan (100 mL) wurde mit Natriumdihydrogenphosphat (14,4 g) und Schwefelsäure (2,4 mL) versetzt und die Lösung auf 10°C gekühlt. Es wurde eine Lösung von Natriumchlorit (3,61 g) in Wasser (100 mL) zugegeben, so dass die Temperatur nicht über 10°C stieg. 15
- 20 Minuten nach beendeter Zugabe wurde Natriumsulfit (4,6 g) zugesetzt. Nach weiteren 15 Minuten wurde mit Salzsäure auf einen pH-Wert von 2 gestellt und das Dioxan am Rotationsverdampfer entfernt. Die wässrige Phase wurde mit Ethylacetat extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Der Rückstand wurde durch präparative HPLC
- 25 gereinigt. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 224,26 (C<sub>12</sub>H<sub>16</sub>O<sub>4</sub>); MS (ESI): 225 (M+H<sup>+</sup>).
- Als Nebenprodukt fiel 4-Butoxy-5-chlor-2-methoxy-benzoesäure an.

##### 4-(1-Propoxy-ethyl)-benzoesäure

- 30 4-(1-Hydroxy-ethyl)-benzoesäuremethylester (2,0 g) gelöst in DMF (30 mL) wurde mit Propyliodid (3,8 g) versetzt und dann Natriumhydrid (50%ig in Öl, 0,53 g) zugegeben. Nach dem Ende der exothermen Reaktion wurde noch 1 Stunde

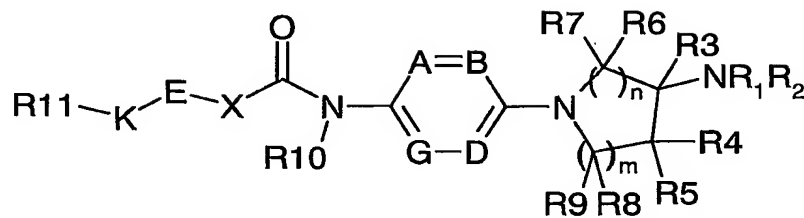
APD62429PC

- gerührt und dann vorsichtig Wasser zur Mischung gegeben. Es wurde mit Ethylacetat extrahiert, die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingeeengt. Der Rückstand wurde nach Methode P-a verseift. Man erhielt so das Produkt mit dem Molekulargewicht 208,26 ( $C_{12}H_{16}O_3$ ); MS (ESI): 209
- 5 (M+H<sup>+</sup>).

APD62429PC

## Patentansprüche

## 1. Verbindungen der Formel I,



5

worin bedeuten

- 10 R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sup>78</sup>R<sup>79</sup>)<sub>o</sub>-R<sup>12</sup>,  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-  
 Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sup>12</sup>,  
 CO-Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, CO-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-  
 Alkynyl, COCH=CH(R<sup>13</sup>), COCC(R<sup>14</sup>), CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-  
 15 S(O)<sub>p</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO(C(R<sup>15</sup>)(R<sup>16</sup>))<sub>q</sub>N(R<sup>17</sup>)(R<sup>18</sup>),  
 CO(C(R<sup>19</sup>)(R<sup>20</sup>))<sub>r</sub>CON(R<sup>21</sup>)(R<sup>22</sup>), CO(C(R<sup>23</sup>)(R<sup>24</sup>))<sub>s</sub>O(R<sup>25</sup>);  
 oder R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an  
 das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi-  
 oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom  
 0 bis 4 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt  
 20 aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das  
 heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann  
 mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-  
 C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-  
 Alkylen-aryl, Oxo, CO(R<sup>26</sup>), CON(R<sup>27</sup>)(R<sup>28</sup>), Hydroxy,  
 25 COO(R<sup>29</sup>), N(R<sup>30</sup>)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R<sup>31</sup>)(R<sup>32</sup>) oder  
 SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

APD62429PC

- o 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;
- p 0, 1, 2;
- 5 q, r, s unabhängig voneinander 0, 1, 2, 3, 4;
- 10 R13, R14 unabhängig voneinander ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- 15 R15, R16, R17, R19, R20, R21, R22, R23, R24, R25 , R26, R27, R28, R29, R30, R31, R32 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;
- R18 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(R33);  
oder  
20 R17 und R18, R21 und R22, R27 und R28, R31 und R32 unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;
- 25 R33 ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- 30 R12 OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R80), CON(R81)(R93), N(R82)(R83), 3-12



APD62429PC

- 5 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der ein oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, Br, J, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, N(R34) (R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R40), S(O)<sub>u</sub> (R41) und COOH enthalten kann;
- 10
- t 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;
- 15 u 0, 1, 2;
- oder
- R34, R35, R37, R38
- unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- 20 R34 und R35
- optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und
- 25 optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;
- R36, R39
- unabhängig voneinander (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl
- 30 substituiert sein kann;

APD62429PC

- 5  
10  
15  
20  
25  
30
- R40 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl;
- R41 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- R78, R79 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl;
- R80, R81,  
R93 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl;
- R82, R83 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;  
oder
- R82 und  
R83 optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;
- R3 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;
- R4, R5 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;
- R6, R7, R8, R9 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl,  
oder

APD62429PC

R6 und R7, R8 und R9

unabhängig voneinander optional Oxo;

n, m unabhängig voneinander 0, 1, 2;

5

A, B, D, G unabhängig voneinander N, C(R42);

oder

die Gruppen A und B oder die Gruppen D und G sind jeweils C(R42) und bilden gemeinsam einen 5- oder 6-gliedrigen carbocyclischen oder heterocyclischen Rest, so dass sich insgesamt ein bicyclisches System ergibt;

10

R42 H, F, Cl, Br, J, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, S-Aryl, N(R43)(R44), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COOH, COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), N(R49)SO<sub>2</sub>(R50), CO(R51), -(CR<sub>84</sub>R<sub>85</sub>)<sub>x</sub>-O(R86);

15

20

R43, R44, R45, R46, R47, R49

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

R43 und R44, R45 und R46

25

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

30

R48, R50, R51

		unabhängig voneinander H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl, Aryl;
	R84, R85	unabhängig voneinander H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl;
5	R86	H, (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, Aryl;
	x	1, 2, 3, 4, 5, 6;
10	R10	H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl, (C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkenyl, (C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkynyl;
	X	N(R52), O, eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), C(R55)(R56)O, CO, C≡C, eine Gruppe der Formel -(CR87R88) <sub>Y</sub> -, worin eine oder mehrere Gruppen -(CR87R88)- durch Y ersetzt sein können, wobei sich ein chemisch sinnvoller Rest ergibt;
15	Y	O, S, N(R89);
	R52, R53, R54, R55, R56	unabhängig voneinander H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl
20	R87, R88	unabhängig voneinander H, (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-Alkyl, wobei R87 und R88 in den y Gruppen jeweils die gleichen oder verschiedene Bedeutungen aufweisen können;
25	y	2, 3, 4, 5, 6;
	R89	H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl;
30	E	3-14 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, J, OH, CF <sub>3</sub> , NO <sub>2</sub> , CN, OCF <sub>3</sub> , Oxo, O-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, O-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-

5

Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, S-Aryl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COOH, COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R59)(R60), N(R61)CO(R62), N(R63)SO<sub>2</sub>(R64), CO(R65) tragen und mono- oder bicyclisch sein kann;

10

R57, R58, R59, R60, R61, R63

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

R57 und R58, R59 und R60

15

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

20

R62, R64, R65

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;

25

K

eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C≡C, C=C, eine Gruppe der Formel -(CR<sub>90</sub>R<sub>91</sub>)<sub>z</sub>-, worin eine oder mehrere Gruppen -(CR<sub>90</sub>R<sub>91</sub>)- durch Z ersetzt sein können, wobei sich ein chemisch sinnvoller Rest ergibt;

v 1, 2, 3, 4;

30

R66, R67, R68, R69, R70

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

	Z	O, S, N(R92), CO, SO, SO <sub>2</sub> ;
5	R90, R91	unabhängig voneinander H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl, Hydroxy-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-Alkyl, Hydroxy, (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-Alkoxy-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-Alkyl, wobei R90 und R91 in den z Gruppen jeweils die gleichen oder verschiedene Bedeutungen aufweisen können;
	z	2, 3, 4, 5, 6;
10	R92	H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl;
15	R11	H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl, (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-Alkoxy-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-alkyl, (C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkenyl, (C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkinyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi-, tri oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF <sub>3</sub> , NO <sub>2</sub> , CN, (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, O-(C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl, (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-Alkoxy-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-alkyl, (C <sub>0</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, Hydroxy-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-alkyl, COO(R74), N(R75)CO(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , SCF <sub>3</sub> ;
20		
	R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77	unabhängig voneinander H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl;
25	oder	
	R72 und R73, R76 und R77	unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann; oder
30		

APD62429PC

E, K und R11 zusammen einen Tricyclus bilden, wobei die Ringe unabhängig voneinander gesättigt, teilgesättigt oder ungesättigt und jeweils 3 – 8 Ringatome enthalten können;

5 deren N-Oxide sowie deren physiologisch verträgliche Salze.

2. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1,

worin bedeuten

10

R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R12, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R12, CO-Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, CO-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, COCH=CH(R13), COCC(R14), CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-S(O)<sub>p</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO(C(R15)(R16))<sub>q</sub>N(R17)(R18), CO(C(R19)(R20))<sub>r</sub>CON(R21)(R22), CO(C(R23)(R24))<sub>s</sub>O(R25); oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi- oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 4 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, Oxo, CO(R26), CON(R27)(R28), Hydroxy, COO(R29), N(R30)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R31)(R32) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

15

20

25

30

o 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

p 0, 1, 2;

APD62429PC

- q, r, s unabhängig voneinander 0, 1, 2, 3, 4;
- 5 R13, R14 unabhängig voneinander ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- 10 R15, R16, R17, R19, R20, R21, R22, R23, R24, R25, R26, R27, R28, R29, R30, R31, R32 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;
- 15 R18 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(R33);
- 20 R17 und R18, R21 und R22, R27 und R28, R31 und R32 unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;
- 25 R33 ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- 30 R12 OH, 3-12 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der ein oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, Br, J, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-



5		Cycloalkyl, (C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )-Cycloalkenyl, O-(C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )-Cycloalkenyl, (C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkynyl, O-(C <sub>0</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkylen-Aryl, N(R34)(R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38)) <sub>t</sub> (R39), CO(C(R37)(R38)) <sub>t</sub> (R39), CO(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, COCOO(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, COO(R40), S(O) <sub>u</sub> (R41) und COOH enthalten kann;
	t	0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;
10	u	0, 1, 2;
	R34, R35, R37, R38	unabhängig voneinander H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl;
15	R34 und R35	optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;
20	R36, R39	unabhängig voneinander (C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )-Cycloalkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF <sub>3</sub> , NO <sub>2</sub> , CN, (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, O-(C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl
25		substituiert sein kann;
	R40	H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl, (C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkenyl, (C <sub>0</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkylen-Aryl;
30	R41	(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, Br, CF <sub>3</sub> , NO <sub>2</sub> , CN, (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, O-(C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl substituiert sein kann;

	R3	H, (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl;
5	R4, R5	unabhängig voneinander H, (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, OH, O-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, O-CO(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, S-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl;
	R6, R7, R8, R9	unabhängig voneinander H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl;
10	R6 und R7, R8 und R9	unabhängig voneinander optional Oxo;
	n, m	unabhängig voneinander 0, 1, 2;
15	A, B, D, G	unabhängig voneinander N, C(R42);
20	R42	H, F, Cl, Br, J, OH, CF <sub>3</sub> , NO <sub>2</sub> , CN, OCF <sub>3</sub> , O-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, O-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-Alkoxy-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-alkyl, S-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, (C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkenyl, (C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )-Cycloalkyl, O-(C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )-Cycloalkyl, (C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )-Cycloalkenyl, O-(C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )-Cycloalkenyl, (C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkynyl, (C <sub>0</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkylen-Aryl, O-(C <sub>0</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkylen-Aryl, S-Aryl, N(R43)(R44), SO <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> , COOH, COO-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-Alkyl, CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), N(R49)SO <sub>2</sub> (R50), CO(R51)
25	R43, R44, R45, R46, R47, R49	unabhängig voneinander H, (C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )-Alkyl;
30	R43 und R44, R45 und R46	unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere

APD62429PC

Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

R48, R50, R51

5 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;

R10 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl;

X N(R52), O, eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), C(R55)(R56)O;

10

R52, R53, R54, R55, R56

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl

E

15

3-8 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, J, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, S-Aryl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COOH, COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R59)(R60), N(R61)CO(R62), N(R63)SO<sub>2</sub>(R64), CO(R65) tragen und mono- oder bicyclisch sein kann;

25

R57, R58, R59, R60, R61, R63

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R57 und R58, R59 und R60

30

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere

APD62429PC

Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

R62, R64, R65

5 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;

K eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R66),  
N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C≡C;

10 v 1, 2, 3, 4

R66, R67, R68, R69, R70

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

15 R11 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl,  
(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi- oder  
spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten  
kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und  
Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein  
20 kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-  
Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, Oxo,  
CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, COO(R74),  
N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

25 R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R72 und R73, R76 und R77

30 unabhängig voneinander optional zusammen mit dem  
Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen  
Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere

APD62429PC

Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann; oder

E, K und R11 zusammen einen Tricyclus bilden, wobei die Ringe  
unabhängig voneinander gesättigt, teilgesättigt oder  
ungesättigt und jeweils 3 – 8 Ringatome enthalten können;

sowie deren physiologisch verträgliche Salze.

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2,

worin bedeuten:

R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R12, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R12, COCH=CH(R13), COCC(R14), CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-S(O)<sub>p</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, CO(C(R15)(R16))<sub>q</sub>N(R17)(R18), CO(C(R19)(R20))<sub>r</sub>CON(R21)(R22), CO(C(R23)(R24))<sub>s</sub>O(R25); oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi- oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterozyklische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, Oxo, CO(R26), CON(R27)(R28), Hydroxy, COO(R29), N(R30)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R31)(R32) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

o 0, 1, 2, 3, 4;

p 0, 1, 2;

- q, r, s unabhängig voneinander 0, 1, 2, 3;
- 5 R13, R14 unabhängig voneinander ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das ein weiteres Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- 10 R15, R16, R17, R19, R20, R21, R22, R23, R24, R25, R26, R27, R28, R29, R30, R31, R32 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;
- R18 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(R33);
- 15 R17 und R18, R21 und R22, R27 und R28, R31 und R32 unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;
- 20 R33 ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- 25 R12 OH, 3-12 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der ein oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, CF<sub>3</sub>, CN, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, N(R34)(R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C(R37)(R38))<sub>t</sub>
- 30

APD62429PC

(R39), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R40) und S(O)<sub>u</sub> (R41) enthalten kann;

t 0, 1, 2, 3, 4;

5

u 0, 1, 2;

R34, R35, R37, R38

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

10

R34 und R35

optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;

15

R36, R39 unabhängig voneinander (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

20

R40 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl;

25

R41 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

30

R3 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

- R4, R5 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;
- 5 R6, R7, R8, R9 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- R6 und R7, R8 und R9 unabhängig voneinander optional Oxo;
- 10 n, m unabhängig voneinander 0, 1, 2;
- A, B, D, G unabhängig voneinander N, C(R42);
- 15 R42 H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-Aryl, N(R43)(R44), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), N(R49)SO<sub>2</sub>(R50), CO(R51)
- 20 R43, R44, R45, R46, R47, R49 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- 25 R43 und R44, R45 und R46 unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;
- 30 R48, R50, R51 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;
- R10 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;



APD62429PC

- X N(R52), O, eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), C(R55)(R56)O;  
R52, R53, R54, R55, R56  
5 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl .
- E 3-8 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische  
Ringstruktur mit 0-4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und  
S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, CF<sub>3</sub>,  
10 NO<sub>2</sub>, OH, CN, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl-  
Aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl-ary, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, COO-  
(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CON(R59)(R60), N(R61)CO(R62),  
N(R63)SO<sub>2</sub>(R64), CO(R65) tragen und mono- oder bicyclisch  
sein kann;  
15
- R57, R58, R59, R60, R61, R63  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- R57 und R58, R59 und R60  
20 unabhängig voneinander optional zusammen mit dem  
Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen  
Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere  
Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und  
Schwefel beinhalten kann;  
25
- R62, R64, R65  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;
- K eine Bindung, O, CH<sub>2</sub>O, N(R66), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, C≡C;  
30
- v 1, 2;

R66, R68, R69, R70

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R11

H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, COO(R74), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R72 und R73, R76 und R77

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann.

4. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, dass

A, B, D, G unabhängig voneinander N oder C(R42) bedeuten und die Gesamtzahl der Stickstoffatome in diesem Ring 0-2 beträgt.

5. Verbindungen der Formel I, gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass

APD62429PC

n 1 und  
m 1 oder 2 bedeuten.

6. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1,  
5  
worin bedeuten:

10 R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sup>78</sup>R<sup>79</sup>)<sub>o</sub>-R<sup>12</sup>,  
(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-  
Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sup>12</sup>, CO-Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl,  
COCH=CH(R<sup>13</sup>), COCC(R<sup>14</sup>),  
CO(C(R<sup>15</sup>)(R<sup>16</sup>))<sub>q</sub>N(R<sup>17</sup>)(R<sup>18</sup>),  
CO(C(R<sup>19</sup>)(R<sup>20</sup>))<sub>r</sub>CON(R<sup>21</sup>)(R<sup>22</sup>), CO(C(R<sup>23</sup>)(R<sup>24</sup>))<sub>s</sub>O(R<sup>25</sup>);  
15 oder R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an  
das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi-  
oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom  
0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt  
aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das  
heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann  
20 mit F, Cl, CF<sub>3</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-  
(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo,  
CO(R<sup>26</sup>), CON(R<sup>27</sup>)(R<sup>28</sup>), Hydroxy, COO(R<sup>29</sup>),  
N(R<sup>30</sup>)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R<sup>31</sup>)(R<sup>32</sup>) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

25 o 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

q, r unabhängig voneinander 1, 2, 3;

s 0, 1, 2, 3, 4;

30 R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup> unabhängig voneinander einen Phenylring, der 0-1  
Stickstoffatome enthalten kann;

APD62429PC

R15, R16, R17, R19, R20, R21, R22, R23, R24, R25 , R26, R27, R28,  
R29, R30, R31, R32

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

5

R18 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(R33);

oder

R17 und R18, R21 und R22, R27 und R28, R31 und R32

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem

10

Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen  
Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere  
Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und  
Schwefel beinhalten kann;

15

R33 ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das ein weiteres  
Heteroatom aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und  
Schwefel enthalten kann und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

20

R12 OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
Alkyl, COO(R80), CON(R81)(R82), 3-12 gliedriger mono-, bi-  
oder spirocyclischer Ring, der ein oder mehrere Heteroatome  
aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12  
gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>,  
CN, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl,  
N(R34)(R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39),  
CO(C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
Alkyl, COO(R40), S(O)<sub>u</sub> (R41) enthalten kann;

25

30

t 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

APD62429PC

- u 0, 1, 2;
- R34, R35, R37, R38
- 5 oder R34 und R35 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- 10 optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;
- 15 R36, R39 unabhängig voneinander (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- 20 R40 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl;
- 25 R41 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- 30 R78, R79 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl;
- R80, R81 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- R3 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;
- R4, R5 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

- R6, R7, R8, R9  
H;  
oder  
5 R6 und R7, R8 und R9  
unabhängig voneinander optional Oxo;
- n 1
- 10 m 1 oder 2;  
A, B, D, G unabhängig voneinander N, C(R42);  
oder  
die Gruppen A und B oder D und G sind jeweils C(R42) und  
15 bilden gemeinsam eine ortho-Phenyleneinheit, so dass sich  
insgesamt ein 1,4-bisubstituiertes Naphthalinsystem ergibt;
- R42 H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-  
C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl,  
O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, N(R43)(R44), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,  
20 CON(R45)(R46), N(R47)CO(R48), CO(R51), -(CR<sub>84</sub>R<sub>85</sub>)<sub>x</sub>-  
O(R86);
- R43, R44, R45, R46, R47  
unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;  
25 oder  
R43 und R44, R45 und R46  
unabhängig voneinander optional zusammen mit dem  
Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen  
Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere  
30 Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und  
Schwefel beinhalten kann;

APD62429PC

R48, R50, R51

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;

R84, R85 H;

5 R86 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

x 0, 1, 2;

R10 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

10

X N(R52), eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), C(R55)(R56)O,  
C≡C, CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>, YCH<sub>2</sub>;

Y O, S, N(R89);

15

R89 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

R52, R53, R54, R55, R56

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl

20

E 3-8 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische  
Ringstruktur mit 0-4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und  
S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, OH,  
CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-  
25 C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, O-  
(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>0</sub>-  
C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, S-Aryl, N(R57)(R58),  
SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, N(R61)CO(R62), N(R63)SO<sub>2</sub>(R64), CO(R65) tragen  
und mono- oder bicyclisch sein kann;

30

R57, R58, R61, R63

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

APD62429PC

R62, R64, R65

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;

5           K           eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R66),  
N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C=C, C≡C,  
SCH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

v           1, 2, 3, 4;

10

R66, R67, R68, R69, R70

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

15           R11           H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl,  
(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi-, tri- oder  
spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten  
kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und  
Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein  
kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-  
20           C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-  
Alkyl-aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy,  
COO(R74), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder  
SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

25           R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

oder

R72 und R73, R76 und R77

30

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem  
Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen  
Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere



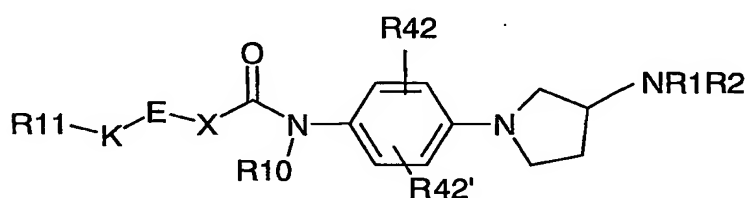
APD62429PC

Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann; oder

deren N-Oxide sowie deren physiologisch verträgliche Salze.

5

7. Verbindungen nach Anspruch 1 oder 6, dadurch gekennzeichnet, dass sie die Formel Ia aufweisen



Ia

10

worin bedeuten

R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi- oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkyl-aryl, Oxo, CO(R<sub>26</sub>), CON(R<sub>27</sub>)(R<sub>28</sub>), Hydroxy, N(R<sub>31</sub>)(R<sub>32</sub>) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, wobei R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> nicht beide gleichzeitig CO(R<sub>26</sub>) sind;

15

20

o 0, 1, 2, 3, 4;

25

q 1, 2, 3;

s 0, 1, 2;

APD62429PC

R15, R16, R17, R18, R23, R24, R25, R26, R27, R28, R31, R32

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

oder

R17 und R18, R27 und R28, R31 und R32

5 unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

10

R12 OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 3-12 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der 1 bis 3 Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, OH, CF<sub>3</sub>, CN, Oxo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, N(R34)(R35), COO(R40), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl enthalten kann;

15

R34, R35

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl;

20

R40 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl;

R78, R79 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl;

25

R42, R42' unabhängig voneinander H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;R10 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

30

X N(R52), eine Bindung, C=C, C(R53)(R54), CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

APD62429PC

R52, R53, R54

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl

5 E 5-7 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische  
Ringstruktur mit 0-3 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und  
S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>,  
OH, CN, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>,  
CO(R65) tragen kann;

10 R65 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

K eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO,  
CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C≡C, SCH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

15 v 1, 2, 3;

R66, R67, R68, R69, R70

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

20 R11 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, ein 3 bis 10-  
gliedriger mono-, bi-, tri- oder spirocyclischer Ring, welcher 0  
bis 4 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der  
Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das  
Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>,  
25 CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Oxo, CO(R71), Hydroxy,  
N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>;

R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

30 oder

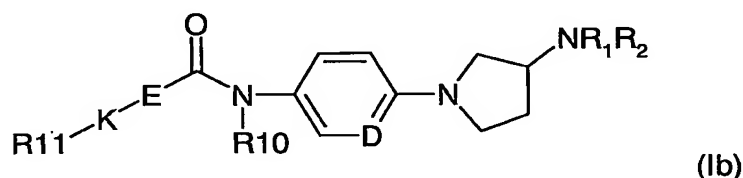
R72 und R73, R76 und R77

APD62429PC

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann; oder

deren N-Oxide sowie deren physiologisch verträgliche Salze.

8. Verbindungen nach Anspruch 1 oder 6, dadurch gekennzeichnet, dass sie die Formel Ib aufweisen



15 worin bedeuten:

R1, R2 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -(CR<sub>78</sub>R<sub>79</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, -CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>-R<sub>12</sub>, CO-Aryloxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, COCH=CH(R<sub>13</sub>), COCC(R<sub>14</sub>), O(C(R<sub>15</sub>)(R<sub>16</sub>))<sub>q</sub>N(R<sub>17</sub>)(R<sub>18</sub>), CO(C(R<sub>19</sub>)(R<sub>20</sub>))<sub>r</sub>CON(R<sub>21</sub>)(R<sub>22</sub>), CO(C(R<sub>23</sub>)(R<sub>24</sub>))<sub>s</sub>O(R<sub>25</sub>); oder R1 und R2 bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4 bis 10-gliedrigen mono-, bi- oder spirocyclischen Ring welcher ausser dem Stickstoffatom 0 bis 2 zusätzliche Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das heterocyclische Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, CF<sub>3</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo,

CO(R26), CON(R27)(R28), Hydroxy, COO(R29),  
N(R30)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R31)(R32) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, wobei R1  
und R2 nicht beide gleichzeitig CO(R26) sind;

5            o            0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;

             q, r            unabhängig voneinander 1, 2, 3;

             s            0, 1, 2, 3, 4;

10

R13, R14    unabhängig voneinander einen Phenylring, der 0-1  
Stickstoffatome enthalten kann;

15

R15, R16, R17, R19, R20, R21, R22, R23, R24, R25 , R26, R27, R28,  
R29, R30, R31, R32

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl;

R18    H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, CO(R33);

oder

20

R17 und R18, R21 und R22, R27 und R28, R31 und R32

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem  
Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen  
Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere  
Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und  
Schwefel beinhalten kann;

25

R33            ein 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das ein weiteres  
Heteroatom aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und  
Schwefel enthalten kann und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;

30

APD62429PC

- 5 R12 OH, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, CN, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R80), CON(R81)(R82), 3-12 gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer Ring, der ein oder mehrere Heteroatome aus der Gruppe N, O und S enthalten kann und der 3-12 gliedrige Ring weitere Substituenten wie F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, CN, Oxo, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-Aryl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, N(R34)(R35), COCH=CH(R36), (C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C(R37)(R38))<sub>t</sub> (R39), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COCOO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, COO(R40), S(O)<sub>u</sub> (R41) enthalten kann;
- 10 t 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6;
- u 0, 1, 2;
- 15 R34, R35, R37, R38
- unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- oder
- 20 R34 und R35
- optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher außer dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten und optional mit 1-2 Oxo-Gruppen substituiert sein kann;
- 25 R36, R39 unabhängig voneinander (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- 30 R40 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl;

APD62429PC

- 5  
R41 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, 5-10 gliedriges aromatisches Ringsystem, das 0-2 weitere Heteroatome aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten und mit F, Cl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl substituiert sein kann;
- R78, R79 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, OH, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl;
- R80, R81 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- 10  
R10 H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl:
- E 3-8 gliedrige bivalente carbo- oder heterocyclische Ringstruktur mit 0-4 Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, die optional Substituenten aus der Gruppe H, F, Cl, Br, OH, CF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, CN, OCF<sub>3</sub>, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, O-(C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, S-Aryl, N(R57)(R58), SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, N(R61)CO(R62), N(R63)SO<sub>2</sub>(R64), CO(R65) tragen und mono- oder bicyclisch sein kann;
- 15  
R57, R58, R61, R63 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;
- 20  
R62, R64, R65 unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, Aryl;
- 25  
K eine Bindung, O, OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R66), N(R67)CO, CON(R68), (C(R69)(R70))<sub>v</sub>, CO, C=C, C≡C, SCH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;
- 30

APD62429PC

v 1, 2, 3, 4;

R66, R67, R68, R69, R70

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

5

R11

H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkinyl, ein 3 bis 10-gliedriger mono-, bi-, tri- oder spirocyclischer Ring, welcher 0 bis 4 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit F, Cl, Br, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, Hydroxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl, (C<sub>0</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylen-aryl, Oxo, CO(R71), CON(R72)(R73), Hydroxy, COO(R74), N(R75)CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, N(R76)(R77) oder SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, SCF<sub>3</sub>;

10

15

R71, R72, R73, R74, R75, R76, R77

unabhängig voneinander H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl;

20

oder

R72 und R73, R76 und R77

unabhängig voneinander optional zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-6 gliedrigen Ring, welcher ausser dem Stickstoffatom noch 0-1 weitere Heteroatome aus der Gruppe N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, Sauerstoff und Schwefel beinhalten kann;

25

deren N-Oxide sowie deren physiologisch verträgliche Salze.

30 9. Arzneimittel enthaltend eine oder mehrere der Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8.



APD62429PC

10. Arzneimittel enthaltend eine oder mehrere der Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 und einen oder mehrere anorektische Wirkstoffe.
- 5 11. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 zur Anwendung als Medikament zur Prophylaxe oder Behandlung der Obesitas.
12. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 zur Anwendung als Medikament zur Prophylaxe oder Behandlung des Typ II Diabetes.
- 10 13. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 in Kombination mit mindestens einem weiteren anorektischen Wirkstoff zur Anwendung als Medikament zur Prophylaxe oder Behandlung der Obesitas.
- 15 14. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 in Kombination mit mindestens einem weiteren anorektischen Wirkstoff zur Anwendung als Medikament zur Prophylaxe oder Behandlung der des Typ II Diabetes.
- 20 15. Verfahren zur Herstellung eines Arzneimittels enthaltend eine oder mehrere der Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, dass der Wirkstoff mit einem pharmazeutisch geeigneten Träger vermischt wird und diese Mischung in eine für die Verabreichung geeignete Form gebracht wird.
- 25 16. Verwendung der Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 zur Herstellung eines Medikaments zur Gewichtsreduktion bei Säugetieren.
- 30 17. Verwendung der Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 zur Herstellung eines Medikaments zur Prophylaxe oder Behandlung der Obesitas.

APD62429PC

18. Verwendung der Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 zur Herstellung eines Medikaments zur Prophylaxe oder Behandlung des Typ II Diabetes.
- 5
19. Verwendung der Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 zur Herstellung eines Medikaments zur Behandlung von Störungen des Empfindens und anderer psychiatrischen Indikationen, sowie zur Behandlung von Störungen assoziiert mit dem zirkadianen Rhythmus und zur Behandlung von Drogenmissbrauch.
- 10
20. Verwendung der Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 als MCH Antagonisten.

15